

特開平10-316634

(43) 公開日 平成10年(1998)12月2日

(51) Int.Cl. ⁶	識別記号	F I	
C 0 7 C 217/18		C 0 7 C 217/18	
A 6 1 K 31/135	ABX	A 6 1 K 31/135	ABX
31/40	ABY	31/40	ABY
	ACB		ACB
	AED		AED
審査請求 未請求 請求項の数21 O L (全 79 頁) 最終頁に続く			

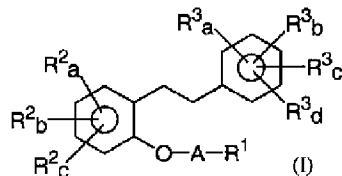
(21) 出願番号	特願平9-125202	(71) 出願人	000001856 三共株式会社 東京都中央区日本橋本町3丁目5番1号
(22) 出願日	平成9年(1997)5月15日	(72) 発明者	藤本 光一 東京都品川区広町1丁目2番58号 三共株式会社内
		(72) 発明者	田中 直樹 東京都品川区広町1丁目2番58号 三共株式会社内
		(72) 発明者	小川 武利 東京都品川区広町1丁目2番58号 三共株式会社内
		(74) 代理人	弁理士 大野 彰夫 (外2名) 最終頁に続く

(54) 【発明の名称】 フェノキシアルキルアミン類

(57) 【要約】 (修正有)

【課題】 すぐれたセロトニン2受容体拮抗作用及びスクアレンシンターゼ阻害活性を持ち、動脈硬化性疾患等の治療剤又は予防剤として有用であるジアリールアルカン類又はその薬理上許容される塩を提供する。

【解決手段】 一般式 I

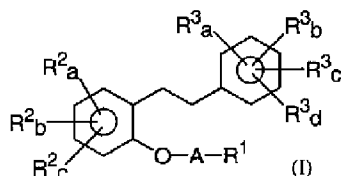


脂環式アミン類又はその薬理上許容される塩。一般式 I の化合物の具体例には 1-メチル-2-[2-[4-フェニル-2-(2-フェニルエチル)フェノキシ]エチル]ピロリジンがある。

【特許請求の範囲】

【請求項1】 一般式

【化1】



[式中、 R^1 は、アミノ基、モノー若しくはジ- $C_1 - C_6$ アルキルアミノ基又は置換されていてもよい、窒素、酸素及び硫黄原子からなる群から選択されるヘテロ原子を1乃至2個含む3乃至6員環状飽和ヘテロシクリル基（該置換基は、炭素原子上の置換基は、ヒドロキシ基、 $C_1 - C_{20}$ アルコキシカルボニルオキシ基、 $C_1 - C_{20}$ アルカノイルオキシ基、カルボキシで置換された $C_2 - C_7$ アルカノイルオキシ基、カルバモイルオキシ基又はモノー若しくはジ- $C_1 - C_6$ アルキルカルバモイルオキシ基を示し、窒素原子上の置換基は、 $C_1 - C_6$ アルキル基、 $C_1 - C_6$ アルキル、 $C_1 - C_6$ アルコキシ若しくはハロゲンで置換されていてもよい $C_6 - C_{10}$ アリールで置換された $C_1 - C_6$ アルキル基、 $C_1 - C_6$ アルキル、 $C_1 - C_6$ アルコキシ若しくはハロゲンで置換されていてもよい $C_6 - C_{10}$ アリール基又は $C_1 - C_9$ アルコキシカルボニル基を示す。）を示し、

R^{2a} 、 R^{2b} 及び R^{2c} は、同一又は異なって、水素原子、 $C_7 - C_{10}$ アルキル基、ハロゲン- $C_1 - C_{10}$ アルキル基、ヒドロキシ基、ブトキシ基、 $C_7 - C_{10}$ アルコキシ基、ハロゲン- $C_1 - C_{10}$ アルコキシ基、 $C_2 - C_{10}$ アルケニル基、 $C_3 - C_{10}$ アルケニルオキシ基、 $C_2 - C_{10}$ アルキニル基、 $C_3 - C_{10}$ アルキニルオキシ基、 $C_1 - C_6$ アルキル、 $C_1 - C_6$ アルコキシ若しくはハロゲンで置換されていてもよい $C_6 - C_{10}$ アリール基又は $C_1 - C_6$ アルキル、 $C_1 - C_6$ アルコキシ基若しくはハロゲンで置換されていてもよい $C_6 - C_{10}$ アリールオキシ基を示すか、或は R^{2a} 、 R^{2b} 及び R^{2c} から選択される2個の基がそれらと結合している炭素原子と共に $C_1 - C_6$ アルキル、 $C_1 - C_6$ アルコキシ若しくはハロゲンで置換されていてもよいフェニル環を形成する基を示し、

R^{3a} 、 R^{3b} 、 R^{3c} および R^{3d} は、同一又は異なって、水素原子、 $C_1 - C_6$ アルキル基、ハロゲン- $C_1 - C_6$ アルキル基、 $C_2 - C_6$ アルケニル基、 $C_2 - C_6$ アルキニル基、 $C_1 - C_6$ アルコキシ基、ハロゲン- $C_1 - C_6$ アルコキシ基、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基又は $C_1 - C_6$ アルキル、 $C_1 - C_6$ アルコキシ若しくはハロゲンで置換されていてもよい $C_6 - C_{10}$ アリール基を示し、

Aは、単結合又は $C_1 - C_6$ アルキレン基を示す。但し、 R^1 がアミノ基又はモノー若しくはジ- $C_1 - C_6$

アルキルアミノ基である場合は、Aは $C_2 - C_6$ アルキレン基を示し、 R^{2a} 、 R^{2b} 及び R^{2c} の1個は、水素原子以外の基を示す。]を有する基を示す。]を有するフェノキシアルキルアミン類又はその薬理上許容される塩。

【請求項2】 R^1 が、ジ- $C_1 - C_6$ アルキルアミノ基又は置換されていてもよい、ピロリジニル基、ピペリジニル基若しくはモルホリニル基（該置換基は、炭素原子上の置換基としては、ヒドロキシ基、 $C_1 - C_{18}$ アルコキシカルボニルオキシ基、 $C_1 - C_{20}$ アルカノイルオキシ基、カルボキシで置換された $C_3 - C_6$ アルカノイルオキシ基、カルバモイルオキシ基又はモノー若しくはジ- $C_1 - C_2$ アルキルカルバモイルオキシ基を示し、窒素原子上の置換基としては、 $C_1 - C_4$ アルキル基又はメチル、メトキシ、弗素若しくは塩素で置換されていてもよいフェニル基を示す。）である請求項1のフェノキシアルキルアミン類又はその薬理上許容される塩。

【請求項3】 R^1 が、ジ- $C_1 - C_4$ アルキルアミノ基又は置換されていてもよい、ピロリジニル基若しくはピペリジニル基（該置換基は、炭素原子上の置換基としては、ヒドロキシ基、 $C_1 - C_4$ アルコキシカルボニルオキシ基、 $C_8 - C_{16}$ アルコキシカルボニルオキシ基、 $C_2 - C_5$ アルカノイルオキシ基、 $C_{10} - C_{18}$ アルカノイルオキシ基、カルボキシで置換された $C_3 - C_6$ アルカノイルオキシ基、カルバモイルオキシ基又はモノー若しくはジ- $C_1 - C_2$ アルキルカルバモイルオキシ基であり、窒素原子上の置換基としては、 $C_1 - C_4$ アルキル基である。）である請求項1のフェノキシアルキルアミン類又はその薬理上許容される塩。

【請求項4】 R^1 が、ジ- $C_1 - C_2$ アルキルアミノ基又は置換されていてもよい、ピロリジニル基若しくはピペリジニル基（該置換基は、炭素原子上の置換基としては、ヒドロキシ、メトキシカルボニルオキシ、エトキシカルボニルオキシ、イソプロポキシカルボニルオキシ、 t -ブトキシカルボニルオキシ、オクチルオキシカルボニルオキシ、デシルオキシカルボニルオキシ、ヘキサデシルオキシカルボニルオキシ、アセトキシ、プロピオニルオキシ、ブチリルオキシ、バレリオルオキシ、ピバロイルオキシ、デカノイルオキシ、ウンデカノイルオキシ、ラウロイルオキシ、ミリストイルオキシ、パルミトイルオキシ、ステアロイルオキシ、スクシニルオキシ、グルタリルオキシ、カルバモイルオキシ、 N -メチルカルバモイルオキシ、 N -エチルカルバモイルオキシ、 N 、 N -ジメチルカルバモイルオキシ又は N 、 N -ジエチルカルバモイルオキシ基であり、窒素原子上の置換基としては、 $C_1 - C_2$ アルキル基である。）である請求項1のフェノキシアルキルアミン類又はその薬理上許容される塩。

【請求項5】 R^1 が、ジメチルアミノ基又は置換されていてもよい、ピロリジニル基又若しくはピペリジニル基（該置換基は、炭素原子上の置換基としては、ヒドロキ

シ、エトキシカルボニルオキシ、イソプロポキシカルボニルオキシ、*t*-ブトキシカルボニルオキシ、オクチルオキシカルボニルオキシ、デカノイルオキシ、ラウロイルオキシ、パルミトイルオキシ、ステアロイルオキシ、スクシニルオキシ、カルバモイルオキシ又はN、N-ジメチルカルバモイルオキシ基であり、窒素原子上の置換基としては、メチル基である。)である請求項1のフェノキシアルキルアミン類又はその薬理上許容される塩。

【請求項6】 R^1 が、ジメチルアミノ基、2-ピロリジニル基、1-メチル-2-ピロリジニル基、4-ヒドロキシ-2-ピロリジニル基、4-エトキシカルボニルオキシ-2-ピロリジニル基、4-イソプロポキシカルボニルオキシ-2-ピロリジニル基、4-*t*-ブトキシカルボニルオキシ-2-ピロリジニル基、4-オクチルオキシカルボニルオキシ-2-ピロリジニル基、4-デカノイルオキシ-2-ピロリジニル基、4-ラウロイルオキシ-2-ピロリジニル基、4-パルミトイルオキシ-2-ピロリジニル基、4-スクシニルオキシ-2-ピロリジニル基、4-N、N-ジメチル-カルバモイルオキシ-2-ピロリジニル基、1-メチル-4-ヒドロキシ-2-ピロリジニル基、1-メチル-4-エトキシカルボニルオキシ-2-ピロリジニル基、1-メチル-4-イソプロポキシカルボニルオキシ-2-ピロリジニル基、1-メチル-4-*t*-ブトキシカルボニルオキシ-2-ピロリジニル基、1-メチル-4-オクチルオキシカルボニルオキシ-2-ピロリジニル基、1-メチル-4-デカノイルオキシ-2-ピロリジニル基、1-メチル-4-ラウロイルオキシ-2-ピロリジニル基、1-メチル-4-パルミトイルオキシ-2-ピロリジニル基、1-メチル-4-スクシニルオキシ-2-ピロリジニル基、1-メチル-4-スクシニルオキシ-2-ピロリジニル基、1-メチル-4-N、N-ジメチルカルバモイルオキシ-2-ピロリジニル基、2-ピペリジニル基又は1-メチル-2-ピペリジニル基である請求項1のフェノキシアルキルアミン類又はその薬理上許容される塩。

【請求項7】 R^1 が、2-ピロリジニル基、1-メチル-2-ピロリジニル基、1-メチル-4-ヒドロキシ-2-ピロリジニル基、1-メチル-4-オクチルオキシカルボニルオキシ-2-ピロリジニル基、1-メチル-4-デカノイルオキシ-2-ピロリジニル基又は1-メチル-4-ラウロイルオキシ-2-ピロリジニル基である請求項1のフェノキシアルキルアミン類又はその薬理上許容される塩。

【請求項8】 R^2a 及び R^2b が、同一または異なって、水素原子、 C_7-C_8 アルキル基、ハロゲン- C_1-C_6 アルキル基、ヒドロキシ基、ブトキシ基、 C_7-C_8 アルコキシ基、ハロゲン- C_1-C_6 アルコキシ基、 C_3-C_6 アルケニル基、 C_3-C_6 アルケニルオキシ基、 C_3-C_6 アルキニル基、 C_3-C_6 アルキニルオキシ

基、 C_1-C_4 アルキル、 C_1-C_4 アルコキシ若しくはハロゲンで置換されていてもよい C_6-C_{10} アリール基又は C_1-C_4 アルキル、 C_1-C_4 アルコキシ若しくはハロゲンで置換されていてもよい C_6-C_{10} アリールオキシ基であるか、或は R^2a 及び R^2b がそれらと結合している炭素原子と共に C_1-C_4 アルキル、 C_1-C_4 アルコキシ若しくはハロゲンで置換されていてもよいフェニル環を形成する基である請求項1乃至7のフェノキシアルキルアミン類又はその薬理上許容される塩。

【請求項9】 R^2a 及び R^2b が、同一または異なって、水素原子、 C_7 アルキル基、弗素で置換された C_1-C_4 アルキル基、ヒドロキシ基、ブトキシ基、 C_7-C_8 アルコキシ基、弗素で置換された C_1-C_4 アルコキシ基、 C_3-C_4 アルケニル基、 C_3-C_4 アルケニルオキシ基、 C_3-C_4 アルキニル基、 C_3-C_4 アルキニルオキシ基、 C_1-C_4 アルキル、 C_1-C_4 アルコキシ若しくはハロゲンで置換されていてもよいフェニル基、ナフチル基、 C_1-C_4 アルキル、 C_1-C_4 アルコキシ若しくはハロゲンで置換されていてもよいフェノキシ基又はナフチルオキシ基であるか、或は R^2a 及び R^2b がそれと結合している炭素原子と共に C_1-C_4 アルキル、 C_1-C_4 アルコキシ若しくはハロゲンで置換されていてもよいフェニル環を形成する基であり、 R^2c が、水素原子である請求項1乃至7のフェノキシアルキルアミン類又はその薬理上許容される塩。

【請求項10】 R^2a 及び R^2b が、同一または異なって、水素原子、ヒドロキシ基、ブトキシ基、ヘプチルオキシ基、オクチルオキシ基、アリル基、アリルオキシ基、プロパギル基、プロパギルオキシ基、 C_1-C_2 アルキル、 C_1-C_2 アルコキシ、弗素原子若しくは塩素原子で置換されていてもよいフェニル基、ナフチル基、 C_1-C_2 アルキル、 C_1-C_2 アルコキシ、弗素原子若しくは塩素原子で置換されていてもよいフェノキシ基またはナフチルオキシ基であるか、或は R^2a 及び R^2b がそれらと結合している炭素原子と共に C_1-C_2 アルキル、 C_1-C_2 アルコキシ、弗素原子若しくは塩素原子で置換されていてもよいフェニル環を形成する基であり、 R^2c が、水素原子である請求項1乃至7のフェノキシアルキルアミン類又はその薬理上許容される塩。

【請求項11】 R^2a 及び R^2b が、同一または異なって、水素原子、メチル、メトキシ、弗素原子若しくは塩素原子で置換されていてもよいフェニル基又はメチル、メトキシ、弗素原子若しくは塩素原子で置換されていてもよいフェノキシ基であるか、或は R^2a 及び R^2b がそれらと結合している炭素原子と共にフェニル環を形成する基であり、 R^2c が、水素原子である請求項1乃至7のフェノキシアルキルアミン類又はその薬理上許容される塩。

【請求項12】 R^3a 、 R^3b 及び R^3c が、同一または異なって、水素原子、 C_1-C_4 アルキル基、ハロゲン- C_1-C_2 アルキル基、 C_3-C_4 アルケニル基、 C_3-C_4

4 アルキニル基、 $C_1 - C_4$ アルコキシ基、ハロゲン- $C_1 - C_2$ アルコキシ基、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基または $C_1 - C_2$ アルキル、 $C_1 - C_2$ アルコキシ若しくはハロゲンで置換されていてもよいフェニル基であり、 R^{3d} が、水素原子である請求項1乃至11のフェノキシアルキルアミン類又はその薬理上許容される塩。

【請求項13】 R^{3a} 、 R^{3b} 及び R^{3c} が、同一または異なって、水素原子、 $C_1 - C_2$ アルキル基、フルオロもしくはクロロ- $C_1 - C_2$ アルキル基、アリル基、プロパルギル基、 $C_1 - C_2$ アルコキシ基、フルオロメトキシ基、ジフルオロメトキシ基、クロロメトキシ基、2-フルオロエトキシ基、2-クロロエトキシ基、弗素原子、塩素原子、臭素原子、シアノ基、ニトロ基又はメチル、メトキシ、弗素もしくは塩素で置換されていてもよいフェニル基であり、 R^{3d} が、水素原子である請求項1乃至11のフェノキシアルキルアミン類又はその薬理上許容される塩。

【請求項14】 R^{3a} 、 R^{3b} 及び R^{3c} が、同一または異なって、水素原子、 $C_1 - C_2$ アルキル基、フルオロメチル基、トリフルオロメチル基、クロロメチル基、 $C_1 - C_2$ アルコキシ基、フルオロメトキシ基、ジフルオロメトキシ基、2-フルオロエトキシ基、弗素原子、塩素原子、臭素原子、シアノ基又はフェニル基であり、 R^{3d} が、水素原子である請求項1乃至11のフェノキシアルキルアミン類又はその薬理上許容される塩。

【請求項15】 R^{3a} 及び、 R^{3b} が、同一または異なって、水素原子、メチル基、メトキシ基、エトキシ基、フルオロメトキシ基、ジフルオロメトキシ基、弗素原子、塩素原子、臭素原子又はシアノ基であり、 R^{3c} 及び R^{3d} が、水素原子である請求項1乃至11のフェノキシアルキルアミン類又はその薬理上許容される塩。

【請求項16】Aが、単結合又は $C_1 - C_4$ アルキレン基である請求項1乃至15のフェノキシアルキルアミン類又はその薬理上許容される塩。

【請求項17】Aが、単結合、メチレン基、エチレン基又はトリメチレン基である請求項1乃至15のフェノキシアルキルアミン類又はその薬理上許容される塩。

【請求項18】Aが、メチレン基、エチレン基又はトリメチレン基である請求項1乃至15のフェノキシアルキルアミン類又はその薬理上許容される塩。

【請求項19】Aが、エチレン基又はトリメチレン基である請求項1乃至15のフェノキシアルキルアミン類又はその薬理上許容される塩。

【請求項20】1-メチル-2-[2-[4-フェニル-2-(2-フェニルエチル)フェノキシ]エチル]ピロリジン、
2-[2-[4-(4-フルオロフェニル)-2-(2-フェニルエチル)フェノキシ]エチル]-1-メチルピロリジン、

2-[2-[4-(4-クロロフェニル)-2-(2-フェニルエチル)フェノキシ]エチル]-1-メチルピロリジン、

2-[2-[2-[2-(3-メトキシフェニル)エチル-4-フェニル]フェノキシ]エチル]-1-メチルピロリジン、

2-[2-[2-[2-(4-フルオロフェニル)エチル]-4-フェニル]フェノキシ]エチル]-1-メチルピロリジン、

2-[2-[2-[2-(4-フルオロ-3-メトキシフェニル)エチル]-4-フェニル]フェノキシ]エチル]-1-メチルピロリジン、

N, N-ジメチル-3-[4-フェニル-2-(2-フェニルエチル)フェノキシ]プロピルアミン、

N, N-ジメチル-3-[2-[2-(3-メトキシフェニル)エチル-4-フェニル]フェノキシ]プロピルアミン、

N, N-ジメチル-3-[2-[2-(4-フルオロフェニル)エチル-4-フェニル]フェノキシ]プロピルアミン、

N, N-ジメチル-3-[2-[2-(4-フルオロ-3-メトキシフェニル)エチル-4-フェニル]フェノキシ]プロピルアミン及びN, N-ジメチル-4-[4-フェニル-2-(2-フェニルエチル)フェノキシ]ブチルアミンからなる群から選択されるフェノキシアルキルアミン類又はその薬理上許容される塩。

【請求項21】請求項1乃至20のフェノキシアルキルアミン類又はその薬理上許容される塩を有効成分として含有する循環器疾患治療剤又は予防剤。

【発明の詳細な説明】

【0001】

【発明の属する技術分野】本発明は優れたセロトニン2受容体拮抗作用及びスクアレンシンターゼ阻害作用を併せ持ち、循環器疾患（血栓性疾患、動脈硬化性疾患又は高脂血症疾患、特に、血栓性疾患）の治療剤もしくは予防剤として、有用なフェノキシアルキルアミン類もしくはその薬理上許容される塩又はそれらを有効成分とするセロトニン2受容体拮抗剤、スクアレンシンターゼ阻害剤もしくは循環器疾患（血栓性疾患、動脈硬化性疾患又は高脂血症疾患、特に、血栓性疾患）の治療剤もしくは予防剤に関する。

【0002】

【従来の技術】セロトニンは、古典的にはオータコイドに分類され、神経伝達物質としても知られており、生体内に於いては種々の受容体をいかして多彩な生理作用を示す。このセロトニンの受容体にはサブタイプが存在することが知られているが、循環器系においては、血管内皮細胞や血小板にセロトニン2受容体に分類される受容体が分布し、血管の収縮や血小板の凝集に深く関っており〔例えば、エス・ジェイ・ペロウトカ等；フェデレー

ジョン・プロシーディング、第42巻、第213頁（1983年）；S. J. Peroutka et al., Fed. Proc., 42, 213（1983）]、その拮抗薬は、血管収縮の防止や血小板凝集阻に役立つ。現在、セロトニン2受容体拮抗薬として、ケタンセリンが知られているが〔例えば、ジェイ・アイ・エス・ロバートソン；カレント・オピニオン・イン・カルディオロジー、第3巻、第702頁（1988年）；J. T. S. Robertson, Curr. Opinion Cardiol., 3, 702（1988）〕、この薬剤はアドレナリン α 1拮抗薬として開発されたもので、強い血圧降下作用を示すという欠点を有する。又、最近、アドレナリン α 1拮抗作用が弱く、すぐれたセロトニン2受容体拮抗作用を有する血小板凝集阻害薬として、ジアリールアルカン誘導体が知られているが〔例えば、ジャーナル・オブ・メディシナル・ケミストリー、第35巻、第189頁（1992年）、同、第33巻、第1818頁（1990年）等；J. Med. Chem., 35, 189（1992）, ibid., 33, 1818（1990）、特開平6-234736号公報、特開平6-306025号公報等〕、これらの化合物がスクアレンシンターゼ阻害作用を有することは全く知られていない。

【0003】一方、高脂血症は動脈硬化症のような虚血性疾患の三大危険因子の一つであり、とりわけ高い血中コレステロール値を下げるのが心臓病の予防になることが認められている。スクアレンシンターゼは、コレステロール合成系において、HMG-CoA還元酵素の数段階下流に位置し、この段階以降コレステロール合成系は他のイソプレノ由来の化合物合成系とは経路を別にする。すなわち、スクアレンシンターゼを阻害するとユビキノンやドリコールなどの生合成を阻害することなく、コレステロールの生合成を抑制することが可能であり〔例えば、ネイチャー、第343巻、第425頁（1990年）；Nature, 343, 425（1990）〕、スクアレンシンターゼ阻害薬は高脂血症治療剤として極めて有用である。なお、スクアレンシンターゼ阻害剤としては、これまで、イソプレノイド（ホイフィニルメチル）ホスフェート、ジオキサジシクロオクタン環を基本骨格に持つザラゴジックアシッド（Zaragozic Acids）等が知られている（米国特許第4,871,721号、米国特許第5,102,907号等）。

【0004】したがって、セロトニン2受容体拮抗作用およびスクアレンシンターゼ阻害作用を併せ持つ化合物は、スクアレンシンターゼ阻害作用による抗高脂血症作用に基づき、動脈硬化の発生、進展を予防、阻止するのみならず、セロトニン2受容体拮抗作用に基づく動脈硬化における血栓形成を阻害し、また血管収縮を抑えることにより循環動態を改善し、これら疾患の予防、治

療作用が期待される。

【0005】

【発明が解決しようとする課題】本発明者等は、フェノキシアルキルアミン誘導体の薬理活性について、永年に亘り鋭意研究を行なった結果、特定のフェノキシアルキルアミン類がセロトニン2受容体拮抗作用及びスクアレンシンターゼ阻害活性を併せ持ち、それらの作用が持続的であること、血小板凝集阻害に基づく血栓性疾患の治療剤又は予防剤として有用であること、コレステロール低下作用に基づく高脂血症及び動脈硬化性疾患の治療剤又は予防剤として有用であること及びセロトニン2受容体拮抗作用とコレステロール低下作用を併せ持つことにより、すぐれた動脈硬化性疾患治療剤又は予防剤として有用であることを見出し、本発明を完成するに至った。

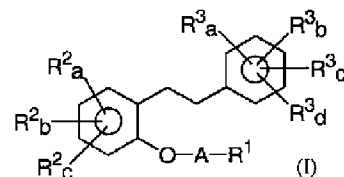
【0006】本発明は、フェノキシアルキルアミン類もしくはその薬理上許容される塩、それらを有効成分とする循環器疾患（血栓性疾患、動脈硬化性疾患又は高脂血症性疾患、特に、血栓性疾患）の治療剤もしくは予防剤を提供する。

【0007】

【課題を解決するための手段】本発明のフェノキシアルキルアミン類は、一般式

【0008】

【化2】



【0009】を有する。

【0010】上記式中、 R^1 は、アミノ基、モノー若しくはジ- C_1-C_6 アルキルアミノ基又は置換されていてもよい、窒素、酸素及び硫黄原子からなる群から選択されるヘテロ原子を1乃至2個含む3乃至6員環状飽和ヘテロシクリル基（該置換基は、炭素原子上の置換基は、ヒドロキシ基、 C_1-C_{20} アルコキシカルボニルオキシ基、 C_1-C_{20} アルカノイルオキシ基、カルボキシで置換された C_2-C_7 アルカノイルオキシ基、カルバモイルオキシ基又はモノー若しくはジ- C_1-C_6 アルキルカルバモイルオキシ基を示し、窒素原子上の置換基は、 C_1-C_6 アルキル基、 C_1-C_6 アルキル、 C_1-C_6 アルコキシ若しくはハロゲンで置換されていてもよい C_6-C_{10} アリールで置換された C_1-C_6 アルキル基、 C_1-C_6 アルキル、 C_1-C_6 アルコキシ若しくはハロゲンで置換されていてもよい C_6-C_{10} アリール基又は C_1-C_9 アルコキシカルボニル基を示す。）を示し、 R^2a 、 R^2b 及び R^2c は、同一又は異なって、水素原子、 C_7-C_{10} アルキル基、ハロゲン- C_1-C_{10} アルキル基、ヒドロキシ基、プトキシ基、 C_7-C

C_1 アルコキシ基、ハロゲン- C_1 - C_{10} アルコキシ基、 C_2 - C_{10} アルケニル基、 C_3 - C_{10} アルケニルオキシ基、 C_2 - C_{10} アルキニル基、 C_3 - C_{10} アルキニルオキシ基、 C_1 - C_6 アルキル基、 C_1 - C_6 アルコキシ若しくはハロゲンで置換されていてもよい C_6 - C_{10} アリール基又は C_1 - C アルキル基、 C_1 - C_6 アルコキシ基若しくはハロゲンで置換されていてもよい C_6 - C_{10} アリールオキシ基を示すか、或は R^{2a} 、 R^{2b} 及び R^{2c} から選択される2個の基がそれらと結合している炭素原子と共に C_1 - C_6 アルキル、 C_1 - C_6 アルコキシ若しくはハロゲンで置換されていてもよいフェニル環を形成する基を示し、 R^{3a} 、 R^{3b} 、 R^{3c} および R^{3d} は、同一又は異なって、水素原子、 C_1 - C_6 アルキル基、ハロゲン- C_1 - C_6 アルキル基、 C_2 - C_6 アルケニル基、 C_2 - C_6 アルキニル基、 C_1 - C_6 アルコキシ基、ハロゲン- C_1 - C_6 アルコキシ基、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基又は C_1 - C_6 アルキル基、 C_1 - C_6 アルコキシ若しくはハロゲンで置換されていてもよい C_6 - C_{10} アリール基を示し、 A は、単結合又は C_1 - C_6 アルキレン基を示す。但し、 R^1 がアミノ基又はモノ-若しくはジ- C_1 - C_6 アルキルアミノ基である場合は、 A は C_2 - C_6 アルキレン基を示し、 R^{2a} 、 R^{2b} 及び R^{2c} の1個は、水素原子以外の基を示す。)を有する基を示す。

【0011】上記一般式(I)において、 R^1 等に含まれる C_1 - C_6 アルキル基或は R^1 等に含まれるモノ-若しくはジ- C_1 - C_6 アルキルアミノ基、モノ-若しくはジ- C_1 - C_6 アルキルカルバモイルオキシ基又は C_1 - C_6 アルコキシ基等の C_1 - C_6 アルキル部分は、例えば、メチル、エチル、プロピル、イソプロピル、ブチル、イソブチル、 s -ブチル、 t -ブチル、ペンチル、ヘキシル基であり得、好適には、 C_1 - C_4 アルキル基であり、更に好適には、メチル基又はエチル基であり、最も好適には、メチル基である。

【0012】 R^1 の置換された、窒素、酸素及び硫黄原子からなる群から選択されるヘテロ原子を1乃至2個含む3乃至6員環状飽和ヘテロシクリル基の飽和ヘテロシクリル部分は、例えば、アジリジニル、アゼチジニル、ピロリジニル、ピペリジニル、ピペラジニル、モルホリニル、チオモルホリニル、イミダゾリジニル、ピラゾリジニル、トリアジニル又はテトラゾリニル基であり得、好適には、アゼチジニル、ピロリジニル、ピペリジニル、モルホリニル又はチオモルホニル基であり、更に好適には、ピロリジニル、ピペリジニル又はモルホリニル基であり、更に好適にはピロリジニル又はピペリジニル基であり、特に好適には、2-ピロリジニル又は3-ピペリジニル基であり、最も好適には、2-ピロリジニル基である。また、 R^1 の置換された、窒素、酸素及び硫黄原子からなる群から選択されるヘテロ原子を1乃至2個含む3乃至6員環状飽和ヘテロシクリル基は、好

適には、その炭素原子で、式-A-を有する基と結合している。

【0013】 R^1 に含まれる C_1 - C_{20} アルコシカルボニルオキシ基の C_1 - C_{20} アルコキシ部分は、例えば、メトキシ、エトキシ、プロポキシ、イソプロポキシ、ブトキシ、イソブトキシ、 s -ブトキシ、 t -ブトキシ、ペンチルオキシ、ヘキシルオキシ、ヘプチルオキシ、オクチルオキシ、ノニルオキシ、デシルオキシ、ウンデシルオキシ、ドデシルオキシ、トリデシルオキシ、テトラデシルオキシ、ペンタデシルオキシ、ヘキサデシルオキシ、ヘプタデシルオキシ、オクタデシルオキシ、ノナデシルオキシ、エイコシルオキシ基であり得、好適には、 C_1 - C_6 又は C_8 - C_{18} アルコキシ基であり、更に好適には、 C_1 - C_4 又は C_8 - C_{18} アルコキシ基であり、更に好適には、エトキシ、イソプロポキシ、 t -ブトキシ、オクチルオキシ、ヘキサデシルオキシ又はオクタデシルオキシ基であり、更にまた好適には、エトキシ基、イソプロポキシ基、 t -ブトキシ、オクチルオキシ又はヘキサデシルオキシ基であり、最も好適には、オクチルオキシ基である。

【0014】 R^1 に含まれる C_1 - C_{20} アルカノイルオキシ基の C_1 - C_{20} アルカノイル部分は、例えば、後述する C_1 - C_6 アルカノイル基、ヘプタノイル、オクタノイル、ノナノイル、デカノイル、ラウロイル、ミリストイル、パルミトイル、ステアロイル、エイコサノイル、ドコサノイル基であり得、好適には、 C_2 - C_6 アルカノイル基又は C_{10} - C_{18} アルカノイル基であり、更に好適には、 C_2 - C_3 アルカノイル基又は C_{10} - C_{16} アルカノイル基であり、更に好適には、デカノイル基、ラウロイル基、ミリストイル基又はパルミトイル基であり、最も好適には、デカノイル基又はラウロイル基である。

【0015】 R^1 に含まれるカルボキシで置換された C_2 - C_7 アルカノイル基は、例えば、マロニル、スクシニル、グルタリル、アジポイル、ビメロイル、スペロイル基であり得、好適には、 C_3 - C_6 アルカノイル基であり、更に好適には、スクシニル又はグルタリル基であり、最も好適にはスクシニル基である。

【0016】 R^1 等に含まれるハロゲン原子は、例えば、弗素、塩素、臭素、沃素原子であり得、好適には、弗素、塩素又は臭素原子であり、更に好適には、弗素又は塩素原子である。

【0017】 R^1 に含まれる C_6 - C_{10} アリールで置換された C_1 - C_6 アルキル基は、1乃至3個の C_6 - C_{10} アリールがアルキル基に置換されていてもよく、例えば、ベンジル、メチルベンジル、メトキシベンジル、フルオロベンジル、クロロベンジル、ブロモベンジル、フェネチル、3-フェニルプロピル、4-フェニルブチル、5-フェニルペンチル、6-フェニルヘキシル、ベンツヒドリル、メチルベンツヒドリル、メトキシベンツ

ヒドリル、フルオロベンツヒドリル、クロロベンツヒドリル、ジフルオロベンツヒドリル、ジクロロベンツヒドリル、トリチル基であり得、好適には、ベンジル、メチルベンジル、メトキシベンジル、フルオロベンジル、クロロベンジル、ブromoベンジル、フェネチル又はベンツヒドリル基であり、最も好適には、ベンジル基である。

【0018】 R^1 に含まれる C_6-C_{10} アリール基、 R^{2a} 等の C_6-C_{10} アリール基又は R^{2a} 等の C_6-C_{10} アリールオキシ基のアリール部分等は、例えば、フェニル、メチルフェニル、メトキシフェニル、フルオロフェニル、クロロフェニル、ブromoフェニル、ナフチル、メチルナフチル又はメトキシナフチル基であり得、好適には、フェニル、メチルフェニル、メトキシフェニル、フルオロフェニル、クロロフェニル又はナフチル基であり、最も好適には、フェニル基である。

【0019】 R^1 に含まれる窒素原子の置換基である C_1-C_9 アルコキシカルボニル基の C_1-C_9 アルコキシ部分は、例えば、メトキシ、エトキシ、プロポキシ、イソプロポキシ、ブトキシ、イソブトキシ、*s*-ブトキシ、*t*-ブトキシ、ペンチルオキシ、ヘキシルオキシ、ヘプチルオキシ、オクチルオキシ、ノニルオキシ基であり得、好適には、 C_1-C_4 アルコキシ基、ヘプチルオキシ基又はオクチルオキシ基であり、更に好適には、 C_1-C_2 アルコキシ基又はオクチルオキシ基であり、最も好適には、メトキシ基である。

【0020】 R^{2a} 等の C_7-C_{10} アルキル基又は C_7-C_{10} アルコキシ基のアルキル部分は、例えば、ヘプチル、イソヘプチル、オクチル、ノニル、デシル基であり得、好適には、 C_7-C_8 アルキル基であり、最も好適には、ヘプチル基である。

【0021】 R^{2a} 等のハロゲン- C_1-C_{10} アルキル基又はハロゲン- C_1-C_{10} アルコキシ基のハロゲン-アルキル部分は、例えば、フルオロメチル、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル、クロロメチル、ブromoメチル、ヨードメチル、2-フルオロエチル、2-クロロエチル、2-ブromoエチル、2-ヨードエチル、3-フルオロプロピル、4-フルオロブチル、5-フルオロペンチル、6-フルオロヘキシル、7-フルオロヘプチル、8-フルオロオクチル、9-フルオロノニル、10-フルオロデシル基であり得、好適には、フルオロメチル、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル、クロロメチル、2-フルオロエチル、2-クロロエチル、3-フルオロプロピル、4-フルオロブチル、5-フルオロペンチル又は6-フルオロヘキシル基であり、更に好適には、フルオロメチル、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル、2-フルオロエチル又は2-クロロエチル基であり、特に好適には、トリフルオロメチル基である。

【0022】 R^{2a} 等の C_2-C_{10} アルケニル基は、例えば、ビニル、アリル、メタアリル、2-ブテニル、2-ペンテニル、2-ヘキセニル、2-ヘプテニル、2-オ

クテニル、2-ノネニル、2-オクテニル基であり得、好適には、 C_3-C_6 アルケニル基であり、更に好適には、アリル基又はメタアリル基であり、最も好適には、アリル基である。

【0023】 R^{2a} 等の C_3-C_{10} アルケニルオキシ基のアルケニル部分は、例えば、アリル、メタアリル、2-ブテニル、2-ペンテニル、2-ヘキセニル、2-ヘプテニル、2-オクテニル、2-ノネニル、2-オクテニル基であり得、好適には、 C_3-C_6 アルケニル基であり、更に好適には、アリル基又はメタアリル基であり、最も好適には、アリル基である。

【0024】 R^{2a} 等の C_2-C_{10} アルキニル基は、例えば、エチニル、プロパルギル、2-ブチニル、2-ペンチニル、2-ヘキシニル、2-ヘプチニル、2-オクチニル、2-ノニニル基であり得、好適には、 C_3-C_6 アルキニル基であり、最も好適には、プロパルギル基である。

【0025】 R^{2a} 等の C_3-C_{10} アルキニルオキシ基のアルキニル部分は、例えば、プロパルギル、2-ブチニル、2-ペンチニル、2-ヘキシニル、2-ヘプチニル、2-オクチニル、2-ノニニル、2-デシニル基であり得、好適には、 C_3-C_6 アルキル基であり、最も好適には、プロパルギル基である。

【0026】 R^{2a} 等が形成する置換されていてもよいフェニル環は、例えば、フェニル、メチルフェニル、メトキシフェニル、フルオロフェニル、クロロフェニル又はブromoフェニル環であり得、好適には、フェニル、メチルフェニル、メトキシフェニル、フルオロフェニル又はクロロフェニル環であり、最も好適には、フェニル環である。

【0027】 R^{3a} 等のハロゲン- C_1-C_6 アルキル基は、例えば、フルオロメチル、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル、クロロメチル、ブromoメチル、ヨードメチル、2-フルオロエチル、2-クロロエチル、2-ブromoエチル、2-ヨードエチル、3-フルオロプロピル、4-フルオロブチル、5-フルオロペンチル、6-フルオロヘキシル基であり得、好適には、フルオロメチル、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル、クロロメチル、2-フルオロエチル又は2-クロロエチル基であり、更に好適には、フルオロメチル、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル、2-フルオロエチル又は2-クロロエチル基であり、特に好適には、トリフルオロメチル基である。

【0028】 R^{3a} 等の C_2-C_6 アルケニル基は、例えば、ビニル、アリル、メタアリル、2-ブテニル、2-ペンテニル、2-ヘキセニル基であり得、好適には、 C_3-C_4 アルケニル基であり、更に好適には、アリル基又はメタアリル基であり、特に好適には、アリル基である。

【0029】 R^{3a} 等の C_2-C_6 アルキニル基は、例え

ば、エチニル、プロパルギル、2-ブチニル、2-ペンチニル、2-ヘキシニル基であり得、好適には、 C_3 - C_4 アルキニル基であり、特に好適には、プロパルギル基である。

【0030】 R^3 等のハロゲン- C_1 - C_6 アルコキシ基は、例えば、フルオロメトキシ、ジフルオロメトキシ、トリフルオロメトキシ、クロロメトキシ、ブロモメトキシ、ヨードメトキシ、2-フルオロエトキシ、2-クロロエトキシ、2-ブロモエトキシ、2-ヨードエトキシ、3-フルオロプロポキシ、4-フルオロブトキシ、5-フルオロペンチルオキシ、6-フルオロヘキシルオキシ基であり得、好適には、フルオロメトキシ、ジフルオロメトキシ、トリフルオロメトキシ、2-フルオロエトキシ又は2-クロロエトキシ基であり、更に好適には、フルオロメトキシ、ジフルオロメトキシ、トリフルオロメトキシ、2-フルオロエトキシ又は2-クロロエトキシ基であり、最も好適には、ジフルオロメトキシ基又は2-フルオロエトキシ基である。

【0031】Aの C_1 - C_6 アルキレン基は、例えば、メチレン、エチレン、プロピレン、トリメチレン、テトラメチレン、ペンタメチレン、ヘキサメチレン基であり得、好適には、 C_1 - C_4 アルキレン基であり、更に好適には、メチレン、エチレン又はトリメチレン基であり、最も好適には、エチレン又はトリメチレン基である。

【0032】また、 R^1 の5乃至6員環状飽和ヘテロシクリル基の環上の置換基は、炭素原子上の置換基として、好適には、ヒドロキシ基、 C_1 - C_{18} アルコキシカルボニルオキシ基、 C_1 - C_{20} アルカノイルオキシ基、カルボキシで置換された C_3 - C_7 アルカノイルオキシ基、カルバモイルオキシ基又はモノ-若しくはジ- C_1 - C_2 アルキルカルバモイル基であり、さらに好適には、ヒドロキシ基、 C_1 - C_4 アルコキシカルボニルオキシ基、 C_8 - C_{16} アルコキシカルボニルオキシ基、 C_2 - C_5 アルカノイルオキシ基、 C_{10} - C_{18} アルカノイルオキシ基、カルボキシで置換された C_3 - C_6 アルカノイルオキシ基、カルバモイルオキシ基又はモノ-若しくはジ- C_1 - C_2 アルキルカルバモイルオキシ基であり、更により好適には、ヒドロキシ、メトキシカルボニルオキシ、エトキシカルボニルオキシ、イソプロポキシカルボニルオキシ、 t -ブトキシカルボニルオキシ、オクチルオキシカルボニルオキシ、デシルオキシカルボニルオキシ、ヘキサデシルオキシカルボニルオキシ、アセトキシ、プロピオニルオキシ、ブチリルオキシ、バレリルオキシ、ピパロイルオキシ、デカノイルオキシ、ウンデカノイルオキシ、ラウロイルオキシ、ミリストイルオキシ、パルミトイルオキシ、ステアロイルオキシ、スクシニルオキシ、グルタリルオキシ、カルバモイルオキシ、 N -メチルカルバモイルオキシ、 N -エチルカルバモイルオキシ又は N 、 N -ジメチルカルバモイルオキシ

基であり、更にまたより好適には、ヒドロキシ、エトキシカルボニルオキシ、イソプロポキシカルボニルオキシ、 t -ブトキシカルボニルオキシ、オクチルオキシカルボニルオキシ、ヘキサデシルオキシカルボニルオキシ、デカノイルオキシ、ラウロイルオキシ、ミリストイルオキシ、パルミトイルオキシ、ステアロイルオキシ、スクシニルオキシ、カルバモイルオキシ又は N 、 N -ジメチルカルバモイルオキシ基であり、特に好適には、ヒドロキシ、エトキシカルボニルオキシ、 t -ブトキシカルボニルオキシ、オクチルオキシカルボニルオキシ、デカノイルオキシ、ラウロイルオキシ、パルミトイルオキシ、スクシニルオキシ又は N 、 N -ジメチルカルバモイルオキシ基であり、最も好適には、ヒドロキシ、デカノイルオキシ、ラウロイルオキシ又はパルミトイルオキシ基であり、また、窒素原子上の置換基として、好適には、 C_1 - C_4 アルキル基又はメチル、メトキシ、フルオロ若しくはクロロで置換されてもよいフェニル基であり、更に好適には、 C_1 - C_4 アルキル基であり、更により好適には C_1 - C_2 アルキル基であり、最も好適には、メチル基である。

【0033】更にまた、 R^1 の窒素、酸素若しくは硫黄原子を含む5乃至6員環状飽和ヘテロシクリル基の具体的なもの、例えば、ピロリジニル、1-メチルピロリジニル、1-エチルピロリジニル、1-プロピルピロリジニル、1-イソプロピルピロリジニル、1-ブチルピロリジニル、1-ペンチルピロリジニル、1-ヘキシルピロリジニル、ヒドロキシピロリジニル、メトキシカルボニルオキシピロリジニル、エトキシカルボニルオキシピロリジニル、プロポキシカルボニルオキシピロリジニル、イソプロポキシカルボニルオキシピロリジニル、ブトキシカルボニルオキシピロリジニル、 t -ブトキシカルボニルオキシピロリジニル、ペンチルオキシカルボニルオキシピロリジニル、ヘキシルオキシカルボニルオキシピロリジニル、オクチルオキシカルボニルオキシピロリジニル、ノニルオキシカルボニルオキシピロリジニル、デシルオキシカルボニルオキシピロリジニル、ウンデシルオキシカルボニルオキシピロリジニル、ドデシルオキシカルボニルオキシピロリジニル、トリデシルオキシカルボニルオキシピロリジニル、ペンタデシルオキシカルボニルオキシピロリジニル、ヘキサデシルオキシカルボニルオキシピロリジニル、ヘプタデシルオキシカルボニルオキシピロリジニル、オクタデシルオキシカルボニルオキシピロリジニル、ホルミルオキシピロリジニル、アセトキシピロリジニル、プロピオニルオキシピロリジニル、ブチリルオキシピロリジニル、バレリルオキシピロリジニル、ピパロイルオキシピロリジニル、ヘキサノイルオキシピロリジニル、3,3-ジメチルブチリルオキシピロリジニル、ヘプタノイルオキシピロリジニル、オクタノイルオキシピロリジニル、ノナノイルオキシピロリジニル、デカノイルオキシピロリジニル、ウン

シプロボキシカルボニルオキシビペリジニル、 ϵ -ブ
 トキシカルボニルオキシビペリジニル、オクチルオキシカル
 ボニルオキシビペリジニル、ノニルオキシカルボニル
 オキシビペリジニル、デシルオキシカルボニルオキシビ
 ペリジニル、ヘキサデシルオキシカルボニルオキシビペ
 リジニル、オクタデシルオキシカルボニルオキシビペリ
 ジニル、アセトキシビペリジニル、プロピオニルオキシ
 ビペリジニル、ブチリルオキシビペリジニル、バレリル
 オキシビペリジニル、ピパロイルオキシビペリジニル、ラ
 カノイルオキシビペリジニル、ラウロイルオキシビペリ
 ジニル、ミリストイルオキシビペリジニル、パルミトイ
 ルオキシビペリジニル、ステアロイルオキシビペリジニ
 ル、スクシニルオキシビペリジニル、グルタリルオキシ
 ビペリジニル、カルバモイルオキシビペリジニル、 N -
 メチルカルバモイルオキシビペリジニル、 N -エチルカル
 バモイルオキシビペリジニル、 N 、 N -ジメチルカル
 バモイルオキシビペリジニル、 1 -メチルーヒドロキシ
 ビペリジニル、 1 -メチルーメトキシカルボニルオキシ
 ビペリジニル、 1 -メチルーエトキシカルボニルオキシ
 ビペリジニル、 1 -メチルーイソプロボキシカルボニル
 オキシビペリジニル、 1 -メチルー ϵ -ブトキシカルボ
 ニルオキシビペリジニル、 1 -メチルーオクチルオキシ
 カルボニルオキシビペリジニル、 1 -メチルーノニルオ
 キシカルボニルオキシビペリジニル、 1 -メチルーデシ
 ルオキシカルボニルオキシビペリジニル、 1 -メチルー
 ヘキサデシルオキシカルボニルオキシビペリジニル、 1 -
 メチルーオクタデシルオキシカルボニルオキシビペリ
 ジニル、 1 -メチルーアセトキシビペリジニル、 1 -メ
 チループロピオニルオキシビペリジニル、 1 -メチルー
 ブチリルオキシビペリジニル、 1 -メチルーバレリルオ
 キシビペリジニル、 1 -メチルーピパロイルオキシビペ
 リジニル、 1 -メチルーデカノイルオキシビペリジニ
 ル、 1 -メチルーラウロイルオキシビペリジニル、 1 -
 メチルーミリストイルオキシビペリジニル、 1 -メチル
 -パルミトイルオキシビペリジニル、 1 -メチル-ステ
 アロイルオキシビペリジニル、 1 -メチル-スクシニル
 オキシビペリジニル、 1 -メチル-グルタリルオキシビ
 ペリジニル、 1 -メチル-カルバモイルオキシビペリジ
 ニル、 1 -メチル- N -メチルカルバモイルオキシビペ
 リジニル、 1 -メチル- N -エチルカルバモイルオキシ
 ビペリジニル、 1 -メチル- N 、 N -ジメチルカルバモ
 イルオキシビペリジニル、 1 -エチルーヒドロキシビペ
 リジニル、 1 -エチルーエトキシカルボニルオキシビペ
 リジニル、 1 -エチルーイソプロボキシカルボニルオキ
 シビペリジニル、 1 -エチルー ϵ -ブトキシカルボニル
 オキシビペリジニル、 1 -エチルーオクチルオキシカル
 ボニルオキシビペリジニル、 1 -エチルーノニルオキシ
 カルボニルオキシビペリジニル、 1 -エチルーデシルオ
 キシカルボニルオキシビペリジニル、 1 -エチルーヘキ
 サデシルオキシカルボニルオキシビペリジニル、 1 -エ

チル-オクタデシルオキシカルボニルオキシビペリジニル、1-エチルーアセトキシビペリジニル、1-エチループロピオニルオキシビペリジニル、1-エチルーブチリルオキシビペリジニル、1-エチルーバレリルオキシビペリジニル、1-エチルーピパロイルオキシビペリジニル、1-エチルーデカノイルオキシビペリジニル、1-エチルーラウロイルオキシビペリジニル、1-エチルーミリストイルオキシビペリジニル、1-エチルーパルミトイルオキシビペリジニル、1-エチルーステアロイルオキシビペリジニル、1-エチルーアクロイルオキシビペリジニル、1-エチルースクシニルオキシビペリジニル、1-エチルーグルタリルオキシビペリジニル、ピペラジニル、4-メチルピペラジニル、1, 4-ジメチルピペラジニル、4-フェニルピペラジニル、モルホリニル、4-メチルモルホリニル、4-エチルモルホリニル、4-プロピルモルホリニル、4-イソプロピルモルホリニル、4-ブチルモルホリニル、4-ペンチルモルホリニル、4-ヘキシルモルホリニル、4-フェニルモルホリニル、チオモルホリニル、4-メチルチオモルホリニル、4-エチルチオモルホリニル、4-プロピルチオモルホリニル、4-イソプロピルチオモルホリニル、4-ブチルチオモルホリニル、4-ペンチルチオモルホリニル、4-ヘキシルチオモルホリニル、4-フェニルチオモルホリニル基であり得、好適には、ピロリジニル、1-メチルピロリジニル、1-エチルピロリジニル、ヒドロキシピロリジニル、メトキシカルボニルオキシピロリジニル、エトキシカルボニルオキシピロリジニル、イソプロポキシカルボニルオキシピロリジニル、*t*-ブトキシカルボニルオキシピロリジニル、オクチルオキシカルボニルオキシピロリジニル、ノニルオキシカルボニルオキシピロリジニル、デシルオキシカルボニルオキシピロリジニル、ヘキサデシルオキシカルボニルオキシピロリジニル、オクタデシルオキシカルボニルオキシピロリジニル、アセトキシピロリジニル、プロピオニルオキシピロリジニル、バレリルオキシピロリジニル、ピパロイルオキシピロリジニル、デカノイルオキシピロリジニル、ウンデカノイルオキシピロリジニル、ラウロイルオキシピロリジニル、ミリストイルオキシピロリジニル、パルミトイルオキシピロリジニル、ステアロイルオキシピロリジニル、スクシニルオキシピロリジニル、グルタリルオキシピロリジニル、カルバモイルオキシピロリジニル、N-メチルカルバモイルオキシピロリジニル、N, N-ジメチルカルバモイルオキシピロリジニル、1-メチルーヒドロキシピロリジニル、1-メチルーメトキシカルボニルオキシピロリジニル、1-メトルーエトキシカルボニルオキシピロリジニル、1-メチルーイソプロポキシカルボニルオキシピロリジニル、1-メチルー*t*-ブトキシカルボニルオキシピロリジニル、1-メチルーオクチルオキシカルボニルオキシピロリジニル、1-メチルーノニルオキシカルボニルオキシピロリジニル、

リジニル、1-メチルーデシルオキシカルボニルオキシ
ピロリジニル、1-メチルーヘキサデシルオキシカルボ
ニルオキシピロリジニル、1-メチルーオクタデシルオ
キシカルボニルオキシピロリジニル、1-メチルーアセ
トキシピロリジニル、1-メチループロピオニルオキシ
ピロリジニル、1-メチルーパレリルオキシピロリジニ
ル、1-メチルーピバロイルオキシピロリジニル、1-
メチルーデカノイルオキシピロリジニル、1-メチルー
ウンデカノイルオキシピロリジニル、1-メチルーラウ
ロイルオキシピロリジニル、1-メチルーミリストイル
オキシピロリジニル、1-メチルーパルミトイルオキシ
ピロリジニル、1-メチルーステアロイルオキシピロリ
ジニル、1-メチルースクシニルオキシハピロリジニル、
1-メチルーグルタリルオキシピロリジニル、1-メチ
ルーカルバモイルオキシピロリジニル、1-メチルーN-
メチルカルバモイルオキシピロリジニル、1-メチルー
N、N-ジメチルカルバモイルオキシピロリジニル、
1-エチルーヒドロキシピロリジニル、1-エチルーメ
トキシカルボニルオキシピロリジニル、1-エチルーエ
トキシカルボニルオキシピロリジニル、1-エチルーイ
ソプロポキシカルボニルオキシピロリジニル、1-エチ
ルーt-ブトキシカルボニルオキシピロリジニル、1-
エチルーオクチルオキシカルボニルオキシピロリジニ
ル、1-エチルーノニルオキシカルボニルオキシピロリ
ジニル、1-エチルーデシルオキシカルボニルオキシピ
ロリジニル、1-エチルーヘキサデシルオキシカルボニ
ルオキシピロリジニル、1-エチルーオクタデシルオキ
シカルボニルオキシピロリジニル、1-エチルーアセト
キシピロリジニル、1-エチループロピオニルオキシピ
ロリジニル、1-エチルーパレリルオキシピロリジニ
ル、1-エチルーピバロイルオキシピロリジニル、1-
エチルーラウロイルオキシピロリジニル、1-エチルー
ミリストイルオキシピロリジニル、1-エチルーパルミ
トイルオキシピロリジニル、1-エチルーステアロイル
オキシピロリジニル、1-エチルースクシニルオキシピ
ロリジニル、1-エチルーグルタリルオキシピロリジニ
ル、1-エチルーカルバモイルオキシピロリジニル、ピ
ペリジニル、1-メチルピペリジニル、1-エチルピペ
リジニル、ヒドロキシピペリジニル、メトキシカルボ
ニルオキシピペリジニル、エトキシカルボニルオキシピ
ペリジニル、イソプロポキシカルボニルオキシピペリジ
ニル、t-ブトキシカルボニルオキシピペリジニル、オク
チルオキシカルボニルオキシピペリジニル、デシルオキ
シカルボニルオキシピペリジニル、ヘキサデシルオキシ
カルボニルオキシピペリジニル、オクタデシルオキシカ
ルボニルオキシピペリジニル、アセトキシピペリジニ
ル、プロピオニルオキシピペリジニル、パレリルオキシ
ピペリジニル、ピバロイルオキシピペリジニル、デカノ
イルオキシピペリジニル、ウンデカノイルオキシピペリ
ジニル、ラウロイルオキシピペリジニル、ミリストイル

オキシピペリジニル、パルミトイルオキシピペリジニ
ル、ステアロイルオキシピペリジニル、スクシニルオキ
シピペリジニル、グルタリルオキシピペリジニル、カル
バモイルオキシピペリジニル、N-メチルカルバモイル
オキシピペリジニル、N、N-ジメチルカルバモイルオ
キシピペリジニル、1-メチルーヒドロキシピペリジニ
ル、1-メチルーメトキシカルボニルオキシピペリジニ
ル、1-メチルーエトキシカルボニルオキシピペリジニ
ル、1-メチルーイソプロポキシカルボニルオキシピペ
リジニル、1-メチルーt-ブトキシカルボニルオキシ
ピペリジニル、1-メチルーオクチルオキシカルボニル
オキシピペリジニル、1-メチルーデシルオキシカルボ
ニルオキシピペリジニル、1-メチルーヘキサデシルオ
キシカルボニルオキシピペリジニル、1-メチルーオク
タデシルオキシカルボニルオキシピペリジニル、1-メ
チルーアセトキシピペリジニル、1-メチループロピオ
ニルオキシピペリジニル、1-メチルーパレリルオキシ
ピペリジニル、1-メチルーピバロイルオキシピペリジ
ニル、1-メチルーデカノイルオキシピペリジニル、1-
メチルーウンデカノイルオキシピペリジニル、1-メ
チルーラウロイルオキシピペリジニル、1-メチルーミ
リストイルオキシピペリジニル、1-メチルーパルミト
イルオキシピペリジニル、1-メチルーステアロイルオ
キシピペリジニル、1-メチルースクシニルオキシピペ
リジニル、1-メチルーグルタリルオキシピペリジニ
ル、1-メチルーカルバモイルオキシピペリジニル、1-
メチルーN、N-ジメチルカルバモイルオキシピペリ
ジニル、1-エチルーヒドロキシピペリジニル、1-エ
チルーメトキシカルボニルオキシピペリジニル、1-エ
チルーエトキシカルボニルオキシピペリジニル、1-エ
チルーイソプロポキシカルボニルオキシピペリジニル、
1-エチルーt-ブトキシカルボニルオキシピペリジニ
ル、1-エチルーオクチルオキシカルボニルオキシピペ
リジニル、1-エチルーデシルオキシカルボニルオキシ
ピペリジニル、1-エチルーヘキサデシルオキシカルボ
ニルオキシピペリジニル、1-エチルーオクタデシルオ
キシカルボニルオキシピペリジニル、1-エチルーアセ
トキシピペリジニル、1-エチループロピオニルオキシ
ピペリジニル、1-エチルーパレリルオキシピペリジニ
ル、1-エチルーピバロイルオキシピペリジニル、1-
エチルーデカノイルオキシピペリジニル、1-エチルー
ラウロイルオキシピペリジニル、1-エチルーミリスト
イルオキシピペリジニル、1-エチルーパルミトイルオ
キシピペリジニル、1-エチルーステアロイルオキシピ
ペリジニル、1-エチルースクシニルオキシピペリジニ
ル、1-エチルーグルタリルオキシピペリジニル、1-
エチルーカルバモイルオキシピペリジニル、モルホリニ
ル、4-メチルモルホリニル又は4-エチルモルホリニ
ル基であり、更に好適には、2-ピロリジニル、3-ピ
ロリジニル、1-メチルー2-ピロリジニル、1-メチ

メチル-4-スクシニルオキシ-2-ピロリジニル、1-メチル-4-カルバモイルオキシ-2-ピロリジニル、1-メチル-4-N, N-ジメチルカルバモイルオキシ-2-ピロリジニル、2-ピペリジニル、3-ピペリジニル、4-ピペリジニル、1-メチル-2-ピペリジニル、1-メチル-3-ピペリジニル又は1-メチル-4-ピペリジニル基であり、特に好適には、2-ピロリジニル、1-メチル-2-ピロリジニル、4-ヒドロキシ-2-ピロリジニル、4-エトキシカルボニルオキシ-2-ピロリジニル、4-イソプロポキシカルボニルオキシ-2-ピロリジニル、4-*t*-ブトキシカルボニルオキシ-2-ピロリジニル、4-オクチルオキシカルボニルオキシ-2-ピロリジニル、4-デカノイルオキシ-2-ピロリジニル、4-ラウロイルオキシ-2-ピロリジニル、4-パルミトイルオキシ-2-ピロリジニル、4-スクシニルオキシ-2-ピロリジニル、4-N, N-ジメチルカルバモイルオキシ-2-ピロリジニル、1-メチル-4-ヒドロキシ-2-ピロリジニル、1-メチル-4-エトキシカルボニルオキシ-2-ピロリジニル、1-メチル-4-イソプロポキシカルボニルオキシ-2-ピロリジニル、1-メチル-4-*t*-ブトキシカルボニルオキシ-2-ピロリジニル、1-メチル-4-オクチルオキシカルボニルオキシ-2-ピロリジニル、1-メチル-4-デカノイルオキシ-2-ピロリジニル、1-メチル-4-ラウロイルオキシ-2-ピロリジニル、1-メチル-4-パルミトイルオキシ-2-ピロリジニル、1-メチル-4-スクシニルオキシ-2-ピロリジニル、1-メチル-4-N, N-ジメチルカルバモイルオキシ-2-ピロリジニル、2-ピペリジニル又は1-メチル-2-ピペリジニル基であり、最も好適には、2-ピロリジニル、1-メチル-2-ピロリジニル、1-メチル-4-ヒドロキシ-2-ピロリジニル、1-メチル-4-オクチルオキシカルボニルオキシ-2-ピロリジニル、1-メチル-4-デカノイルオキシ-2-ピロリジニル又は1-メチル-4-ラウロイルオキシ-2-ピロリジニル基である。

【0034】本発明の化合物(I)は、常法に従って酸と処理することより、相当する薬理上許容し得る酸付加塩に変えることができる。このような酸付加塩の例としては、例えば、塩酸、臭化水素酸、硫酸、リン酸等の無機酸、酢酸、安息香酸、シュウ酸、マレイン酸、フマル酸、酒石酸、クエン酸等の有機酸、メタンスルホン酸、ベンゼンスルホン酸、*p*-トルエンスルホン酸等の等スルホン酸による付加塩があげられる。

【0035】更に、化合物(I)の分子内に不斉炭素が存在する場合は、ラセミ体および光学活性体(好適には、2R-体)を包含し、化合物(I)又はその塩の水和物も包含する。

【0036】一般式(I)を有する化合物において、好適には、(1) R^1 が、ジ- $C_1 - C_6$ アルキルアミノ

基又は置換されていてもよい、ピロリジニル基、ピペリジニル基若しくはモルホリニル基(該置換基は、炭素原子上の置換基としては、ヒドロキシ基、 $C_1 - C_{18}$ アルコキシカルボニルオキシ基、 $C_1 - C_{20}$ アルカノイルオキシ基、カルボキシで置換された $C_3 - C_6$ アルカノイルオキシ基、カルバモイルオキシ基又はモノ-若しくはジ- $C_1 - C_2$ アルキルカルバモイルオキシ基を示し、窒素原子上の置換基としては、 $C_1 - C_4$ アルキル基又はメチル、メトキシ、弗素若しくは塩素で置換されていてもよいフェニル基を示す。)である化合物、(2) R^1 が、ジ- $C_1 - C_4$ アルキルアミノ基又は置換されていてもよい、ピロリジニル基若しくはピペリジニル基

(該置換基は、炭素原子上の置換基としては、ヒドロキシ基、 $C_1 - C_4$ アルコキシカルボニルオキシ基、 $C_8 - C_{16}$ アルコキシカルボニルオキシ基、 $C_2 - C_5$ アルカノイルオキシ基、 $C_{10} - C_{18}$ アルカノイルオキシ基、カルボキシで置換された $C_3 - C_6$ アルカノイルオキシ基、カルバモイルオキシ基又はモノ-若しくはジ- $C_1 - C_2$ アルキルカルバモイルオキシ基であり、窒素原子上の置換基としては、 $C_1 - C_4$ アルキル基である。)である化合物、(3) R^1 が、ジ- $C_1 - C_2$ アルキルアミノ基又は置換されていてもよい、ピロリジニル基若しくはピペリジニル基(該置換基は、炭素原子上の置換基としては、ヒドロキシ、メトキシカルボニルオキシ、エトキシカルボニルオキシ、イソプロポキシカルボニルオキシ、*t*-ブトキシカルボニルオキシ、オクチルオキシカルボニルオキシ、デシルオキシカルボニルオキシ、ヘキサデシルオキシカルボニルオキシ、アセトキシ、プロピオニルオキシ、ブチリルオキシ、バレリオールオキシ、ピバロイルオキシ、デカノイルオキシ、ウンデカノイルオキシ、ラウロイルオキシ、ミリストイルオキシ、パルミトイルオキシ、ステアロイルオキシ、スクシニルオキシ、グルタリルオキシ、カルバモイルオキシ、N-メチルカルバモイルオキシ、N-エチルカルバモイルオキシ、N, N-ジメチルカルバモイルオキシ又はN, N-ジエチルカルバモイルオキシ基であり、窒素原子上の置換基としては、 $C_1 - C_2$ アルキル基である。)である化合物、(4) R^1 が、ジメチルアミノ基又は置換されていてもよい、ピロリジニル基又若しくはピペリジニル基(該置換基は、炭素原子上の置換基としては、ヒドロキシ、エトキシカルボニルオキシ、イソプロポキシカルボニルオキシ、*t*-ブトキシカルボニルオキシ、オクチルオキシカルボニルオキシ、デカノイルオキシ、ラウロイルオキシ、パルミトイルオキシ、ステアロイルオキシ、スクシニルオキシ、カルバモイルオキシ又はN, N-ジメチルカルバモイルオキシ基であり、窒素原子上の置換基としては、メチル基である。)である化合物、

(5) R^1 が、ジメチルアミノ基、2-ピロリジニル基、1-メチル-2-ピロリジニル基、4-ヒドロキシ-2-ピロリジニル基、4-エトキシカルボニルオキシ

(5) R^1 が、ジメチルアミノ基、2-ピロリジニル基、1-メチル-2-ピロリジニル基、4-ヒドロキシ-2-ピロリジニル基、4-エトキシカルボニルオキシ

ー2-ピロリジニル基、4-イソプロポキシカルボニルオキシ-2-ピロリジニル基、4-*t*-ブトキシカルボニルオキシ-2-ピロリジニル基、4-オクチルオキシカルボニルオキシ-2-ピロリジニル基、4-デカノイルオキシ-2-ピロリジニル基、4-ラウロイルオキシ-2-ピロリジニル基、4-パルミトイルオキシ-2-ピロリジニル基、4-スクシニルオキシ-2-ピロリジニル基、4-N, N-ジメチルカルバモイルオキシ-2-ピロリジニル基、1-メチル-4-ヒドロキシ-2-ピロリジニル基、1-メチル-4-エトキシカルボニルオキシ-2-ピロリジニル基、1-メチル-4-イソプロポキシカルボニルオキシ-2-ピロリジニル基、1-メチル-4-*t*-ブトキシカルボニルオキシ-2-ピロリジニル基、1-メチル-4-オクチルオキシカルボニルオキシ-2-ピロリジニル基、1-メチル-4-デカノイルオキシ-2-ピロリジニル基、1-メチル-4-ラウロイルオキシ-2-ピロリジニル基、1-メチル-4-パルミトイルオキシ-2-ピロリジニル基、1-メチル-4-スクシニルオキシ-2-ピロリジニル基、1-メチル-4-スクシニルオキシ-2-ピロリジニル基、1-メチル-4-N, N-ジメチルカルバモイルオキシ-2-ピロリジニル基、2-ピペリジニル基又は1-メチル-2-ピペリジニル基である化合物、(6) R¹が、2-ピロリジニル基、1-メチル-2-ピロリジニル基、1-メチル-4-ヒドロキシ-2-ピロリジニル基、1-メチル-4-オクチルオキシカルボニルオキシ-2-ピロリジニル基、1-メチル-4-デカノイルオキシ-2-ピロリジニル基又は1-メチル-4-ラウロイルオキシ-2-ピロリジニル基である化合物、

(7) R^{2a}及びR^{2b}が、同一または異なって、水素原子、C₇-C₈アルキル基、ハロゲン-C₁-C₆アルキル基、ヒドロキシ基、ブトキシ基、C₇-C₈アルコキシ基、ハロゲン-C₁-C₆アルコキシ基、C₃-C₆アルケニル基、C₃-C₆アルケニルオキシ基、C₃-C₆アルキニル基、C₃-C₆アルキニルオキシ基、C₁-C₄アルキル、C₁-C₄アルコキシ若しくはハロゲンで置換されていてもよいC₆-C₁₀アリール基又はC₁-C₄アルキル、C₁-C₄アルコキシ若しくはハロゲンで置換されていてもよいC₆-C₁₀アリールオキシ基であるか、或はR^{2a}及びR^{2b}がそれらと結合している炭素原子と共にC₁-C₄アルキル、C₁-C₄アルコキシ若しくはハロゲンで置換されていてもよいフェニル環を形成する基である化合物、(8) R^{2a}及びR^{2b}が、同一または異なって、水素原子、C₇アルキル基、弗素で置換されたC₁-C₄アルキル基、ヒドロキシ基、ブトキシ基、C₇-C₈アルコキシ基、弗素で置換されたC₁-C₄アルコキシ基、C₃-C₄アルケニル基、C₃-C₄アルケニルオキシ基、C₃-C₄アルキニル基、C₃-C₄アルキニルオキシ基、C₁-C₄アルキル、C₁-C₄アルコキシ若しくはハロゲンで置換

されていてもよいフェニル基、ナフチル基、C₁-C₄アルキル、C₁-C₄アルコキシ若しくはハロゲンで置換されていてもよいフェノキシ基又はナフチルオキシ基であるか、或はR^{2a}及びR^{2b}がそれと結合している炭素原子と共にC₁-C₄アルキル、C₁-C₄アルコキシ若しくはハロゲンで置換されていてもよいフェニル環を形成する基であり、R^{2c}が、水素原子である化合物、

(9) R^{2a}及びR^{2b}が、同一または異なって、水素原子、ヒドロキシ基、ブトキシ基、ヘプチルオキシ基、オクチルオキシ基、アリル基、アリルオキシ基、プロパギル基、プロパギルオキシ基、C₁-C₂アルキル、C₁-C₂アルコキシ、弗素原子若しくは塩素原子で置換されていてもよいフェニル基、ナフチル基、C₁-C₂アルキル、C₁-C₂アルコキシ、弗素原子若しくは塩素原子で置換されていてもよいフェノキシ基またはナフチルオキシ基であるか、或はR^{2a}及びR^{2b}がそれらと結合している炭素原子と共にC₁-C₂アルキル、C₁-C₂アルコキシ、弗素原子若しくは塩素原子で置換されていてもよいフェニル環を形成する基であり、R^{2c}が、水素原子である化合物、(10) R^{2a}及びR^{2b}が、同一または異なって、水素原子、メチル、メトキシ、弗素原子若しくは塩素原子で置換されていてもよいフェニル基又はメチル、メトキシ、弗素原子若しくは塩素原子で置換されていてもよいフェノキシ基であるか、或はR^{2a}及びR^{2b}がそれらと結合している炭素原子と共にフェニル環を形成する基であり、R^{2c}が、水素原子である化合物、

(11) R^{3a}、R^{3b}及びR^{3c}が、同一または異なって、水素原子、C₁-C₄アルキル基、ハロゲン-C₁-C₂アルキル基、C₃-C₄アルケニル基、C₃-C₄アルキニル基、C₁-C₄アルコキシ基、ハロゲン-C₁-C₂アルコキシ基、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基またはC₁-C₂アルキル、C₁-C₂アルコキシ若しくはハロゲンで置換されていてもよいフェニル基であり、R^{3d}が、水素原子である化合物、(12) R^{3a}、R^{3b}及びR^{3c}が、同一または異なって、水素原子、C₁-C₂アルキル基、フルオロもしくはクロロ-C₁-C₂アルキル基、アリル基、プロパギル基、C₁-C₂アルコキシ基、フルオロメトキシ基、ジフルオロメトキシ基、クロロメトキシ基、2-フルオロエトキシ基、2-クロロエトキシ基、弗素原子、塩素原子、臭素原子、シアノ基、ニトロ基又はメチル、メトキシ、弗素もしくは塩素で置換されていてもよいフェニル基であり、R^{3d}が、水素原子である化合物、(13) R^{3a}、R^{3b}及びR^{3c}が、同一または異なって、水素原子、C₁-C₂アルキル基、フルオロメチル基、トリフルオロメチル基、クロロメチル基、C₁-C₂アルコキシ基、フルオロメトキシ基、ジフルオロメトキシ基、2-フルオロエトキシ基、弗素原子、塩素原子、臭素原子、シアノ基又はフェニル基であり、R^{3d}が、水素原子である化合物、(14) R^{3a}及びR^{3b}が、同一または異なって、水素原

子、メチル基、メトキシ基、エトキシ基、フルオロメトキシ基、ジフルオロメトキシ基、弗素原子、塩素原子、臭素原子又はシアノ基であり、 R^3c 及び R^3d が、水素原子である化合物、(15) Aが、単結合又は $C_1 - C_4$ アルキレン基である化合物、(16) Aが、単結合、メチレン基、エチレン基又はトリメチレン基である化合物、(17) Aが、メチレン基、エチレン基又はトリメチレン基である化合物又は(18) Aが、エチレン基又はトリメチレン基である化合物をあげることができる。尚、(1)乃至(6)群、(7)乃至(10)群、(11)乃至(14)群及び(15)乃至(18)群については、群番号が大きくなるにつれて、より好適なものを示す。

【0037】又、 R^1 を(1) - (6)から選択し、 R^{2a} 、 R^{2b} 及び R^{2c} を(7) - (10)から選択し、 R^{3a} 、 R^{3b} 、 R^{3c} 及び R^{3d} を(11) - (14)から選択し、Aを(15) - (18)から選択し、それらを任意に組み合わせたものも好適であり、例えば、以下のものを挙げることができる。

【0038】(19) R^1 が、ジ- $C_1 - C_6$ アルキルアミノ基又は置換されていてもよい、ピロリジニル基、ピペリジニル基若しくはモルホリニル基(該置換基は、炭素原子上の置換基としては、ヒドロキシ基、 $C_1 - C_{18}$ アルコキシカルボニルオキシ基、 $C_1 - C_{20}$ アルカノイルオキシ基、カルボキシで置換された $C_3 - C_6$ アルカノイルオキシ基、カルバモイルオキシ基又はモノ-若しくはジ- $C_1 - C_2$ アルキルカルバモイルオキシ基を示し、窒素原子上の置換基としては、 $C_1 - C_4$ アルキル基又はメチル、メトキシ、弗素若しくは塩素で置換されていてもよいフェニル基を示す。)であり、 R^{2a} 及び R^{2b} が、同一または異なって、水素原子、 $C_7 - C_8$ アルキル基、ハロゲン- $C_1 - C_6$ アルキル基、ヒドロキシ基、ブトキシ基、 $C_7 - C_8$ アルコキシ基、ハロゲン- $C_1 - C_6$ アルコキシ基、 $C_3 - C_6$ アルケニル基、 $C_3 - C_6$ アルケニルオキシ基、 $C_3 - C_6$ アルキニル基、 $C_3 - C_6$ アルキニルオキシ基、 $C_1 - C_4$ アルキル、 $C_1 - C_4$ アルコキシ若しくはハロゲンで置換されていてもよい $C_6 - C_{10}$ アリール基又は $C_1 - C_4$ アルキル、 $C_1 - C_4$ アルコキシ若しくはハロゲンで置換されていてもよい $C_6 - C_{10}$ アリールオキシ基であるか、或は R^{2a} 及び R^{2b} がそれらと結合している炭素原子と共に $C_1 - C_4$ アルキル、 $C_1 - C_4$ アルコキシ若しくはハロゲンで置換されていてもよいフェニル環を形成する基であり、 R^{3a} 、 R^{3b} 及び R^{3c} が、同一または異なって、水素原子、 $C_1 - C_4$ アルキル基、ハロゲン $C_1 - C_2$ アルキル基、 $C_3 - C_4$ アルケニル基、 $C_3 - C_4$ アルキニル基、 $C_1 - C_4$ アルコキシ基、ハロゲン- $C_1 - C_2$ アルコキシ基、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基または $C_1 - C_2$ アルキル、 $C_1 - C_2$ アルコキシ若しくはハロゲンで置換されていてもよいフェニル基で

あり、 R^3d が、水素原子であり、Aが、単結合又は $C_1 - C_4$ アルキレン基である化合物、(20) R^1 が、ジ- $C_1 - C_4$ アルキルアミノ基又は置換されていてもよい、ピロリジニル基若しくはピペリジニル基(該置換基は、炭素原子上の置換基としては、ヒドロキシ基、 $C_1 - C_4$ アルコキシカルボニルオキシ基、 $C_8 - C_{16}$ アルコキシカルボニルオキシ基、 $C_2 - C_5$ アルカノイルオキシ基、 $C_{10} - C_{18}$ アルカノイルオキシ基、カルボキシで置換された $C_3 - C_6$ アルカノイルオキシ基、カルバモイルオキシ基又はモノ-若しくはジ- $C_1 - C_2$ アルキルカルバモイルオキシ基であり、窒素原子上の置換基としては、 $C_1 - C_4$ アルキル基である。)であり、 R^{2a} 及び R^{2b} が、同一または異なって、水素原子、 C_7 アルキル基、弗素で置換された $C_1 - C_4$ アルキル基、ヒドロキシ基、ブトキシ基、 $C_7 - C_8$ アルコキシ基、弗素で置換された $C_1 - C_4$ アルコキシ基、 $C_3 - C_4$ アルケニル基、 $C_3 - C_4$ アルケニルオキシ基、 $C_3 - C_4$ アルキニル基、 $C_3 - C_4$ アルキニルオキシ基、 $C_1 - C_4$ アルキル、 $C_1 - C_4$ アルコキシ若しくはハロゲンで置換されていてもよいフェニル基、ナフチル基、 $C_1 - C_4$ アルキル、 $C_1 - C_4$ アルコキシ若しくはハロゲンで置換されていてもよいフェノキシ基又はナフチルオキシ基であるか、或は R^{2a} 及び R^{2b} がそれと結合している炭素原子と共に $C_1 - C_4$ アルキル、 $C_1 - C_4$ アルコキシ若しくはハロゲンで置換されていてもよいフェニル環を形成する基であり、 R^{2c} が、水素原子であり、 R^{3a} 、 R^{3b} 及び R^{3c} が、同一または異なって、水素原子、 $C_1 - C_2$ アルキル基、フルオロ-もしくはクロロ- $C_1 - C_2$ アルキル基、アリル基、プロパルギル基、 $C_1 - C_2$ アルコキシ基、フルオロメトキシ基、ジフルオロメトキシ基、クロロメトキシ基、2-フルオロエトキシ基、2-クロロエトキシ基、弗素原子、塩素原子、臭素原子、シアノ基、ニトロ基又はメチル、メトキシ、弗素もしくは塩素で置換されていてもよいフェニル基であり、 R^3d が、水素原子であり、Aが、単結合、メチレン基、エチレン基又はトリメチレン基である化合物、

(21) R^1 が、ジ- $C_1 - C_2$ アルキルアミノ基又は置換されていてもよい、ピロリジニル基若しくはピペリジニル基(該置換基は、炭素原子上の置換基としては、ヒドロキシ、メトキシカルボニルオキシ、エトキシカルボニルオキシ、イソプロポキシカルボニルオキシ、*t*-ブトキシカルボニルオキシ、オクチルオキシカルボニルオキシ、デシルオキシカルボニルオキシ、ヘキサデシルオキシカルボニルオキシ、アセトキシ、プロピオニルオキシ、ブチリルオキシ、バレリオールオキシ、ピバロイルオキシ、デカノイルオキシ、ウンデカノイルオキシ、ラウロイルオキシ、ミリストイルオキシ、パルミトイルオキシ、ステアロイルオキシ、スクシニルオキシ、グルタリルオキシ、カルバモイルオキシ、N-メチルカルバモイルオキシ、N-エチルカルバモイルオキシ、N、N-

ジメチルカルバモイルオキシ又はN, N-ジエチルカルバモイルオキシ基であり、窒素原子上の置換基としては、 $C_1 - C_2$ アルキル基である。)であり、 R^{2a} 及び R^{2b} が、同一または異なって、水素原子、 C_7 アルキル基、弗素で置換された $C_1 - C_4$ アルキル基、ヒドロキシ基、ブトキシ基、 $C_7 - C_8$ アルコキシ基、弗素で置換された $C_1 - C_4$ アルコキシ基、 $C_3 - C_4$ アルケニル基、 $C_3 - C_4$ アルケニルオキシ基、 $C_3 - C_4$ アルキニル基、 $C_3 - C_4$ アルキニルオキシ基、 $C_1 - C_4$ アルキル、 $C_1 - C_4$ アルコキシ若しくはハロゲンで置換されていてもよいフェニル基、ナフチル基、 $C_1 - C_4$ アルキル、 $C_1 - C_4$ アルコキシ若しくはハロゲンで置換されていてもよいフェノキシ基又はナフチルオキシ基であるか、或は R^{2a} 及び R^{2b} がそれと結合している炭素原子と共に $C_1 - C_4$ アルキル、 $C_1 - C_4$ アルコキシ若しくはハロゲンで置換されていてもよいフェニル環を形成する基であり、 R^{2c} が、水素原子であり、 R^{3a} 、 R^{3b} 及び R^{3c} が、同一または異なって、水素原子、 $C_1 - C_2$ アルキル基、フルオロもしくはクロロ- $C_1 - C_2$ アルキル基、アリル基、プロパギル基、 $C_1 - C_2$ アルコキシ基、フルオロメトキシ基、ジフルオロメトキシ基、クロロメトキシ基、2-フルオロエトキシ基、2-クロロエトキシ基、弗素原子、塩素原子、臭素原子、シアノ基、ニトロ基又はメチル、メトキシ、弗素もしくは塩素で置換されていてもよいフェニル基であり、 R^{3d} が、水素原子であり、Aが、単結合、メチレン基、エチレン基又はトリメチレン基である化合物、(22) R^1 が、ジメチルアミノ基又は置換されていてもよい、ピロリジニル基又若しくはピペリジニル基(該置換基は、炭素原子上の置換基としては、ヒドロキシ、エトキシカルボニルオキシ、イソプロポキシカルボニルオキシ、*t*-ブトキシカルボニルオキシ、オクチルオキシカルボニルオキシ、デカノイルオキシ、ラウロイルオキシ、パルミトイルオキシ、ステアロイルオキシ、スクシニルオキシ、カルバモイルオキシ又はN, N-ジメチルカルバモイルオキシ基であり、窒素原子上の置換基としては、メチル基である。)であり、 R^{2a} 及び R^{2b} が、同一または異なって、水素原子、ヒドロキシ基、ブトキシ基、ヘプチルオキシ基、オクチルオキシ基、アリル基、アリルオキシ基、プロパギル基、プロパギルオキシ基、 $C_1 - C_2$ アルキル、 $C_1 - C_2$ アルコキシ、弗素原子若しくは塩素原子で置換されていてもよいフェニル基、ナフチル基、 $C_1 - C_2$ アルキル、 $C_1 - C_2$ アルコキシ、弗素原子若しくは塩素原子で置換されていてもよいフェノキシ基またはナフチルオキシ基であるか、或は R^{2a} 及び R^{2b} がそれらと結合している炭素原子と共に $C_1 - C_2$ アルキル、 $C_1 - C_2$ アルコキシ、弗素原子若しくは塩素原子で置換されていてもよいフェニル環を形成する基であり、 R^{2c} が、水素原子であり、 R^{3a} 、 R^{3b} 及び R^{3c} が、同一または異なって、水素原子、 $C_1 - C_2$

アルキル基、フルオロメチル基、トリフルオロメチル基、クロロメチル基、 $C_1 - C_2$ アルコキシ基、フルオロメトキシ基、ジフルオロメトキシ基、2-フルオロエトキシ基、弗素原子、塩素原子、臭素原子、シアノ基又はフェニル基であり、 R^{3d} が、水素原子であり、Aが、メチレン基、エチレン基又はトリメチレン基である化合物、(23) R^1 が、ジメチルアミノ基、2-ピロリジニル基、1-メチル-2-ピロリジニル基、4-ヒドロキシ-2-ピロリジニル基、4-エトキシカルボニルオキシ-2-ピロリジニル基、4-イソプロポキシカルボニルオキシ-2-ピロリジニル基、4-*t*-ブトキシカルボニルオキシ-2-ピロリジニル基、4-オクチルオキシカルボニルオキシ-2-ピロリジニル基、4-デカノイルオキシ-2-ピロリジニル基、4-ラウロイルオキシ-2-ピロリジニル基、4-パルミトイルオキシ-2-ピロリジニル基、4-スクシニルオキシ-2-ピロリジニル基、4-N, N-ジメチルカルバモイルオキシ-2-ピロリジニル基、1-メチル-4-ヒドロキシ-2-ピロリジニル基、1-メチル-4-エトキシカルボニルオキシ-2-ピロリジニル基、1-メチル-4-イソプロポキシカルボニルオキシ-2-ピロリジニル基、1-メチル-4-*t*-ブトキシカルボニルオキシ-2-ピロリジニル基、1-メチル-4-オクチルオキシカルボニルオキシ-2-ピロリジニル基、1-メチル-4-デカノイルオキシ-2-ピロリジニル基、1-メチル-4-ラウロイルオキシ-2-ピロリジニル基、1-メチル-4-パルミトイルオキシ-2-ピロリジニル基、1-メチル-4-スクシニルオキシ-2-ピロリジニル基、1-メチル-4-N, N-ジメチルカルバモイルオキシ-2-ピロリジニル基、2-ピペリジニル基又は1-メチル-2-ピペリジニル基であり、 R^{2a} 及び R^{2b} が、同一または異なって、水素原子、ヒドロキシ基、ブトキシ基、ヘプチルオキシ基、オクチルオキシ基、アリル基、アリルオキシ基、プロパギル基、プロパギルオキシ基、 $C_1 - C_2$ アルキル、 $C_1 - C_2$ アルコキシ、弗素原子若しくは塩素原子で置換されていてもよいフェニル基、ナフチル基、 $C_1 - C_2$ アルキル、 $C_1 - C_2$ アルコキシ、弗素原子若しくは塩素原子で置換されていてもよいフェノキシ基またはナフチルオキシ基であるか、或は R^{2a} 及び R^{2b} がそれらと結合している炭素原子と共に $C_1 - C_2$ アルキル、 $C_1 - C_2$ アルコキシ、弗素原子若しくは塩素原子で置換されていてもよいフェニル環を形成する基であり、 R^{2c} が、水素原子であり、 R^{3a} 、 R^{3b} 及び R^{3c} が、同一または異なって、水素原子、 $C_1 - C_2$ アルキル基、フルオロメチル基、トリフルオロメチル基、クロロメチル基、 $C_1 - C_2$ アルコキシ基、フルオロメトキシ基、ジフルオロメトキシ基、2-フルオロエトキシ基、弗素原子、塩素原子、臭素原子、シアノ基又はフェニル基であり、 R^{3d} が、水素原子

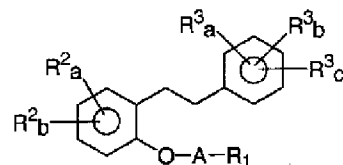
であり、Aが、メチレン基、エチレン基又はトリメチレン基である化合物、(24) R¹ が、2-ピロリジニル基、1-メチル-2-ピロリジニル基、1-メチル-4-ヒドロキシ-2-ピロリジニル基、1-メチル-4-オクチルオキシカルボニルオキシ-2-ピロリジニル基、1-メチル-4-デカノイルオキシ-2-ピロリジニル基又は1-メチル-4-ラウロイルオキシ-2-ピロリジニル基であり、R^{2a}及びR^{2b}が、同一または異なって、水素原子、メチル、メトキシ、弗素原子若しくは塩素原子で置換されていてもよいフェニル基又はメチル、メトキシ、弗素原子若しくは塩素原子で置換されていてもよいフェノキシ基であるか、或はR^{2a}及びR^{2b}がそれらと結合している炭素原子と共にフェニル環を形成する基であり、R^{2c}が、水素原子であり、R^{3a}及び、R^{3b}が、同一または異なって、水素原子、メチル基、メトキシ基、エトキシ基、フルオロメトキシ基、ジフルオロメトキシ基、弗素原子、塩素原子、臭素原子又はシアノ

基であり、R^{3c}及びR^{3d}が、水素原子であり、Aが、エチレン基又はトリメチレン基である化合物。

【0039】一般式(I)における好適な化合物として、次の表1に示す化合物を具体的に例示することができる。なお、下記化3の化合物は、化合物(I)において、R^{2c}及びR^{3d}が水素原子の化合物である。

【0040】

【化3】



【0041】

【表1】

例示化合物 番号 No.	-A-R ¹	R ^{2a} & R ^{2b}	R ^{3a} , R ^{3b} & R ^{3c}
1	CH ₂ CH ₂ NH ₂	4-0c	H
2	CH ₂ CH ₂ NH ₂	4-CF ₃	H
3	CH ₂ CH ₂ NH ₂	4-OH	H
4	CH ₂ CH ₂ NH ₂	4-OBu	H
5	CH ₂ CH ₂ NH ₂	4-OHp	H
6	CH ₂ CH ₂ NH ₂	4-00c	H
7	CH ₂ CH ₂ NH ₂	4-OCF ₃	H
8	CH ₂ CH ₂ NH ₂	4-CH ₂ CH=CH ₂	H
9	CH ₂ CH ₂ NH ₂	4-O-CH ₂ CH=CH ₂	H
10	CH ₂ CH ₂ NH ₂	4-CH ₂ C≡CH	H
11	CH ₂ CH ₂ NH ₂	4-O-CH ₂ C≡CH	H
12	CH ₂ CH ₂ NH ₂	4-Ph	H
13	CH ₂ CH ₂ NH ₂	5-Ph	H
14	CH ₂ CH ₂ NH ₂	6-Ph	H
15	CH ₂ CH ₂ NH ₂	4-(4-Me-Ph)	H
16	CH ₂ CH ₂ NH ₂	4-(4-OMe-Ph)	H
17	CH ₂ CH ₂ NH ₂	4-(4-F-Ph)	H
18	CH ₂ CH ₂ NH ₂	4-(4-Cl-Ph)	H
19	CH ₂ CH ₂ NH ₂	6-(4-Me-Ph)	H
20	CH ₂ CH ₂ NH ₂	6-(4-OMe-Ph)	H
21	CH ₂ CH ₂ NH ₂	6-(4-F-Ph)	H
22	CH ₂ CH ₂ NH ₂	6-(4-Cl-Ph)	H
23	CH ₂ CH ₂ NH ₂	4-OPh	H
24	CH ₂ CH ₂ NH ₂	5-OPh	H
25	CH ₂ CH ₂ NH ₂	6-OPh	H
26	CH ₂ CH ₂ NH ₂	4-0(4-Me-Ph)	H
27	CH ₂ CH ₂ NH ₂	4-0(4-OMe-Ph)	H
28	CH ₂ CH ₂ NH ₂	4-0(4-F-Ph)	H
29	CH ₂ CH ₂ NH ₂	4-0(4-Cl-Ph)	H

30	CH ₂ CH ₂ NH ₂	6-O (4-Me-Ph)	H
31	CH ₂ CH ₂ NH ₂	6-O (4-OMe-Ph)	H
32	CH ₂ CH ₂ NH ₂	6-O (4-F-Ph)	H
33	CH ₂ CH ₂ NH ₂	6-O (4-Cl-Ph)	H
34	CH ₂ CH ₂ NH ₂	3, 4- (CH=CH-CH=CH) -	H
35	CH ₂ CH ₂ NH ₂	4, 5- (CH=CH-CH=CH) -	H
36	CH ₂ CH ₂ NH ₂	5, 6- (CH=CH-CH=CH) -	H
37	CH ₂ CH ₂ NHMe	4-OH	H
38	CH ₂ CH ₂ NHMe	4-OBu	H
39	CH ₂ CH ₂ NHMe	4-OOc	H
40	CH ₂ CH ₂ NHMe	4-CH ₂ CH=CH ₂	H
41	CH ₂ CH ₂ NHMe	4-O-CH ₂ CH=CH ₂	H
42	CH ₂ CH ₂ NHMe	4-CH ₂ C≡CH	H
43	CH ₂ CH ₂ NHMe	4-O-CH ₂ C≡CH	H
44	CH ₂ CH ₂ NHMe	4-Ph	H
45	CH ₂ CH ₂ NHMe	5-Ph	H
46	CH ₂ CH ₂ NHMe	6-Ph	H
47	CH ₂ CH ₂ NHMe	4-OPh	H
48	CH ₂ CH ₂ NHMe	5-OPh	H
49	CH ₂ CH ₂ NHMe	6-OPh	H
50	CH ₂ CH ₂ NHMe	3, 4- (CH=CH-CH=CH) -	H
51	CH ₂ CH ₂ NHMe	4, 5- (CH=CH-CH=CH) -	H
52	CH ₂ CH ₂ NHMe	5, 6- (CH=CH-CH=CH) -	H
53	CH ₂ CH ₂ NMe ₂	4-Hp	H
54	CH ₂ CH ₂ NMe ₂	4-CF ₃	H
55	CH ₂ CH ₂ NMe ₂	4-OH	H
56	CH ₂ CH ₂ NMe ₂	4-OBu	H
57	CH ₂ CH ₂ NMe ₂	6-OBu	H
58	CH ₂ CH ₂ NMe ₂	4-OHp	H
59	CH ₂ CH ₂ NMe ₂	4-OOc	H
60	CH ₂ CH ₂ NMe ₂	4-OCF ₃	H
61	CH ₂ CH ₂ NMe ₂	4-CH ₂ CH=CH ₂	H
62	CH ₂ CH ₂ NMe ₂	4-O-CH ₂ CH=CH ₂	H
63	CH ₂ CH ₂ NMe ₂	4-CH ₂ C≡CH	H
64	CH ₂ CH ₂ NMe ₂	4-O-CH ₂ C≡CH	H
65	CH ₂ CH ₂ NMe ₂	4-Ph	H
66	CH ₂ CH ₂ NMe ₂	5-Ph	H
67	CH ₂ CH ₂ NMe ₂	6-Ph	H
68	CH ₂ CH ₂ NMe ₂	4- (4-Me-Ph)	H
69	CH ₂ CH ₂ NMe ₂	4- (4-OMe-Ph)	H
70	CH ₂ CH ₂ NMe ₂	4- (4-F-Ph)	H
71	CH ₂ CH ₂ NMe ₂	4- (4-Cl-Ph)	H
72	CH ₂ CH ₂ NMe ₂	6- (4-Me-Ph)	H
73	CH ₂ CH ₂ NMe ₂	6- (4-OMe-Ph)	H
74	CH ₂ CH ₂ NMe ₂	6- (4-F-Ph)	H
75	CH ₂ CH ₂ NMe ₂	6- (4-Cl-Ph)	H
76	CH ₂ CH ₂ NMe ₂	4-OPh	H
77	CH ₂ CH ₂ NMe ₂	5-OPh	H
78	CH ₂ CH ₂ NMe ₂	6-OPh	H
79	CH ₂ CH ₂ NMe ₂	4-O- (4-Me-Ph)	H

80	CH ₂ CH ₂ NMe ₂	4-O- (4-OMe-Ph)	H
81	CH ₂ CH ₂ NMe ₂	4-O- (4-F-Ph)	H
82	CH ₂ CH ₂ NMe ₂	4-O- (4-Cl-Ph)	H
83	CH ₂ CH ₂ NMe ₂	6-O- (4-Me-Ph)	H
84	CH ₂ CH ₂ NMe ₂	6-O- (4-OMe-Ph)	H
85	CH ₂ CH ₂ NMe ₂	6-O- (4-F-Ph)	H
86	CH ₂ CH ₂ NMe ₂	6-O- (4-Cl-Ph)	H
87	CH ₂ CH ₂ NMe ₂	3, 4- (CH=CH-CH=CH) -	H
88	CH ₂ CH ₂ NMe ₂	4, 5- (CH=CH-CH=CH) -	H
89	CH ₂ CH ₂ NMe ₂	5, 6- (CH=CH-CH=CH) -	H
90	CH ₂ CH ₂ NMeEt	4-OH	H
91	CH ₂ CH ₂ NMeEt	4-OBu	H
92	CH ₂ CH ₂ NMeEt	4-OOc	H
93	CH ₂ CH ₂ NMeEt	4-CH ₂ CH=CH ₂	H
94	CH ₂ CH ₂ NMeEt	4-O-CH ₂ CH=CH ₂	H
95	CH ₂ CH ₂ NMeEt	4-CH ₂ C≡CH	H
96	CH ₂ CH ₂ NMeEt	4-O-CH ₂ C≡CH	H
97	CH ₂ CH ₂ NMeEt	4-Ph	H
98	CH ₂ CH ₂ NMeEt	5-Ph	H
99	CH ₂ CH ₂ NMeEt	6-Ph	H
100	CH ₂ CH ₂ NMeEt	4-OPh	H
101	CH ₂ CH ₂ NMeEt	5-OPh	H
102	CH ₂ CH ₂ NMeEt	6-OPh	H
103	CH ₂ CH ₂ NMeEt	3, 4- (CH=CH-CH=CH) -	H
104	CH ₂ CH ₂ NMeEt	4, 5- (CH=CH-CH=CH) -	H
105	CH ₂ CH ₂ NMeEt	5, 6- (CH=CH-CH=CH) -	H
106	CH ₂ CH ₂ (2-Pyr)	4-Hp	H
107	CH ₂ CH ₂ (2-Pyr)	4-CF ₃	H
108	CH ₂ CH ₂ (2-Pyr)	4-OH	H
109	CH ₂ CH ₂ (2-Pyr)	4-OBu	H
110	CH ₂ CH ₂ (2-Pyr)	6-OBu	H
111	CH ₂ CH ₂ (2-Pyr)	4-OHp	H
112	CH ₂ CH ₂ (2-Pyr)	4-OOc	H
113	CH ₂ CH ₂ (2-Pyr)	4-OCF ₃	H
114	CH ₂ CH ₂ (2-Pyr)	4-CH ₂ CH=CH ₂	H
115	CH ₂ CH ₂ (2-Pyr)	4-O-CH ₂ CH=CH ₂	H
116	CH ₂ CH ₂ (2-Pyr)	4-CH ₂ C≡CH	H
117	CH ₂ CH ₂ (2-Pyr)	4-O-CH ₂ C≡CH	H
118	CH ₂ CH ₂ (2-Pyr)	4-Ph	H
119	CH ₂ CH ₂ (2-Pyr)	5-Ph	H
120	CH ₂ CH ₂ (2-Pyr)	6-Ph	H
121	CH ₂ CH ₂ (2-Pyr)	4- (4-Me-Ph)	H
122	CH ₂ CH ₂ (2-Pyr)	4- (4-OMe-Ph)	H
123	CH ₂ CH ₂ (2-Pyr)	4- (4-F-Ph)	H
124	CH ₂ CH ₂ (2-Pyr)	4- (4-Cl-Ph)	H
125	CH ₂ CH ₂ (2-Pyr)	6- (4-Me-Ph)	H
126	CH ₂ CH ₂ (2-Pyr)	6- (4-OMe-Ph)	H
127	CH ₂ CH ₂ (2-Pyr)	6- (4-F-Ph)	H
128	CH ₂ CH ₂ (2-Pyr)	6- (4-Cl-Ph)	H
129	CH ₂ CH ₂ (2-Pyr)	4-OPh	H

130	CH ₂ CH ₂ (2-Pyr)	5-OPh	H
131	CH ₂ CH ₂ (2-Pyr)	6-OPh	H
132	CH ₂ CH ₂ (2-Pyr)	4-O- (4-Me-Ph)	H
133	CH ₂ CH ₂ (2-Pyr)	4-O- (4-OMe-Ph)	H
134	CH ₂ CH ₂ (2-Pyr)	4-O- (4-F-Ph)	H
135	CH ₂ CH ₂ (2-Pyr)	4-O- (4-Cl-Ph)	H
136	CH ₂ CH ₂ (2-Pyr)	6-O- (4-Me-Ph)	H
137	CH ₂ CH ₂ (2-Pyr)	6-O- (4-OMe-Ph)	H
138	CH ₂ CH ₂ (2-Pyr)	6-O- (4-F-Ph)	H
140	CH ₂ CH ₂ (2-Pyr)	3, 4- (CH=CH-CH=CH) -	H
141	CH ₂ CH ₂ (2-Pyr)	4, 5- (CH=CH-CH=CH) -	H
142	CH ₂ CH ₂ (2-Pyr)	5, 6- (CH=CH-CH=CH) -	H
143	CH ₂ CH ₂ (1-Me-2-Pyr)	4-Hp	H
144	CH ₂ CH ₂ (1-Me-2-Pyr)	4-CF ₃	H
145	CH ₂ CH ₂ (1-Me-2-Pyr)	4-OH	H
146	CH ₂ CH ₂ (1-Me-2-Pyr)	4-OBu	H
147	CH ₂ CH ₂ (1-Me-2-Pyr)	6-OBu	H
148	CH ₂ CH ₂ (1-Me-2-Pyr)	4-OHp	H
149	CH ₂ CH ₂ (1-Me-2-Pyr)	4-OOc	H
150	CH ₂ CH ₂ (1-Me-2-Pyr)	4-OCF ₃	H
151	CH ₂ CH ₂ (1-Me-2-Pyr)	4-CH ₂ CH=CH ₂	H
152	CH ₂ CH ₂ (1-Me-2-Pyr)	4-O-CH ₂ CH=CH ₂	H
153	CH ₂ CH ₂ (1-Me-2-Pyr)	4-CH ₂ C≡CH	H
154	CH ₂ CH ₂ (1-Me-2-Pyr)	4-O-CH ₂ C≡CH	H
155	CH ₂ CH ₂ (1-Me-2-Pyr)	4-Ph	H
156	CH ₂ CH ₂ (1-Me-2-Pyr)	5-Ph	H
157	CH ₂ CH ₂ (1-Me-2-Pyr)	6-Ph	H
158	CH ₂ CH ₂ (1-Me-2-Pyr)	4- (4-Me-Ph)	H
159	CH ₂ CH ₂ (1-Me-2-Pyr)	4- (4-OMe-Ph)	H
160	CH ₂ CH ₂ (1-Me-2-Pyr)	4- (4-F-Ph)	H
161	CH ₂ CH ₂ (1-Me-2-Pyr)	4- (4-Cl-Ph)	H
162	CH ₂ CH ₂ (1-Me-2-Pyr)	6- (4-Me-Ph)	H
163	CH ₂ CH ₂ (1-Me-2-Pyr)	6- (4-OMe-Ph)	H
164	CH ₂ CH ₂ (1-Me-2-Pyr)	6- (4-F-Ph)	H
165	CH ₂ CH ₂ (1-Me-2-Pyr)	6- (4-Cl-Ph)	H
166	CH ₂ CH ₂ (1-Me-2-Pyr)	4-OPh	H
167	CH ₂ CH ₂ (1-Me-2-Pyr)	5-OPh	H
168	CH ₂ CH ₂ (1-Me-2-Pyr)	6-OPh	H
169	CH ₂ CH ₂ (1-Me-2-Pyr)	4-O- (4-Me-Ph)	H
170	CH ₂ CH ₂ (1-Me-2-Pyr)	4-O- (4-OMe-Ph)	H
171	CH ₂ CH ₂ (1-Me-2-Pyr)	4-O- (4-F-Ph)	H
172	CH ₂ CH ₂ (1-Me-2-Pyr)	4-O- (4-Cl-Ph)	H
173	CH ₂ CH ₂ (1-Me-2-Pyr)	6-O- (4-Me-Ph)	H
174	CH ₂ CH ₂ (1-Me-2-Pyr)	6-O- (4-OMe-Ph)	H
175	CH ₂ CH ₂ (1-Me-2-Pyr)	6-O- (4-F-Ph)	H
176	CH ₂ CH ₂ (1-Me-2-Pyr)	6-O- (4-Cl-Ph)	H
177	CH ₂ CH ₂ (1-Me-2-Pyr)	3, 4- (CH=CH-CH=CH) -	H
178	CH ₂ CH ₂ (1-Me-2-Pyr)	4, 5- (CH=CH-CH=CH) -	H
179	CH ₂ CH ₂ (1-Me-2-Pyr)	5, 6- (CH=CH-CH=CH) -	H
180	CH ₂ CH ₂ (4-OH-2-Pyr)	4-OH	H

181	CH ₂ CH ₂ (4-OH-2-Pyr)	4-OBu	H
182	CH ₂ CH ₂ (4-OH-2-Pyr)	4-OOc	H
183	CH ₂ CH ₂ (4-OH-2-Pyr)	4-O-CH ₂ CH=CH ₂	H
184	CH ₂ CH ₂ (4-OH-2-Pyr)	4-O-CH ₂ C≡CH	H
185	CH ₂ CH ₂ (4-OH-2-Pyr)	4-Ph	H
186	CH ₂ CH ₂ (4-OH-2-Pyr)	5-Ph	H
187	CH ₂ CH ₂ (4-OH-2-Pyr)	6-Ph	H
188	CH ₂ CH ₂ (4-OH-2-Pyr)	4-OPh	H
189	CH ₂ CH ₂ (4-OH-2-Pyr)	5-OPh	H
190	CH ₂ CH ₂ (4-OH-2-Pyr)	6-OPh	H
191	CH ₂ CH ₂ (4-OH-2-Pyr)	3, 4-(CH=CH-CH=CH)-	H
192	CH ₂ CH ₂ (4-OH-2-Pyr)	4, 5-(CH=CH-CH=CH)-	H
193	CH ₂ CH ₂ (4-OH-2-Pyr)	5, 6-(CH=CH-CH=CH)-	H
194	CH ₂ CH ₂ (4-OCOOc-2-Pyr)	4-OH	H
195	CH ₂ CH ₂ (4-OCOOc-2-Pyr)	4-OBu	H
196	CH ₂ CH ₂ (4-OCOOc-2-Pyr)	4-OOc	H
197	CH ₂ CH ₂ (4-OCOOc-2-Pyr)	4-O-CH ₂ CH=CH ₂	H
198	CH ₂ CH ₂ (4-OCOOc-2-Pyr)	4-O-CH ₂ C≡CH	H
199	CH ₂ CH ₂ (4-OCOOc-2-Pyr)	4-Ph	H
200	CH ₂ CH ₂ (4-OCOOc-2-Pyr)	5-Ph	H
201	CH ₂ CH ₂ (4-OCOOc-2-Pyr)	6-Ph	H
202	CH ₂ CH ₂ (4-OCOOc-2-Pyr)	4-OPh	H
203	CH ₂ CH ₂ (4-OCOOc-2-Pyr)	5-OPh	H
204	CH ₂ CH ₂ (4-OCOOc-2-Pyr)	6-OPh	H
205	CH ₂ CH ₂ (4-OCOOc-2-Pyr)	3, 4-(CH=CH-CH=CH)-	H
206	CH ₂ CH ₂ (4-OCOOc-2-Pyr)	4, 5-(CH=CH-CH=CH)-	H
207	CH ₂ CH ₂ (4-OCOOc-2-Pyr)	5, 6-(CH=CH-CH=CH)-	H
208	CH ₂ CH ₂ (4-ODec-2-Pyr)	4-OH	H
209	CH ₂ CH ₂ (4-ODec-2-Pyr)	4-OBu	H
210	CH ₂ CH ₂ (4-ODec-2-Pyr)	4-OOc	H
211	CH ₂ CH ₂ (4-ODec-2-Pyr)	4-O-CH ₂ CH=CH ₂	H
212	CH ₂ CH ₂ (4-ODec-2-Pyr)	4-O-CH ₂ C≡CH	H
213	CH ₂ CH ₂ (4-ODec-2-Pyr)	4-Ph	H
214	CH ₂ CH ₂ (4-ODec-2-Pyr)	5-Ph	H
215	CH ₂ CH ₂ (4-ODec-2-Pyr)	6-Ph	H
216	CH ₂ CH ₂ (4-ODec-2-Pyr)	4-OPh	H
217	CH ₂ CH ₂ (4-ODec-2-Pyr)	5-OPh	H
218	CH ₂ CH ₂ (4-ODec-2-Pyr)	6-OPh	H
219	CH ₂ CH ₂ (4-ODec-2-Pyr)	3, 4-(CH=CH-CH=CH)-	H
220	CH ₂ CH ₂ (4-ODec-2-Pyr)	4, 5-(CH=CH-CH=CH)-	H
221	CH ₂ CH ₂ (4-ODec-2-Pyr)	5, 6-(CH=CH-CH=CH)-	H
222	CH ₂ CH ₂ (4-OLau-2-Pyr)	4-OH	H
223	CH ₂ CH ₂ (4-OLau-2-Pyr)	4-OBu	H
224	CH ₂ CH ₂ (4-OLau-2-Pyr)	4-OOc	H
225	CH ₂ CH ₂ (4-OLau-2-Pyr)	4-O-CH ₂ CH=CH ₂	H
226	CH ₂ CH ₂ (4-OLau-2-Pyr)	4-O-CH ₂ C≡CH	H
227	CH ₂ CH ₂ (4-OLau-2-Pyr)	4-Ph	H
228	CH ₂ CH ₂ (4-OLau-2-Pyr)	5-Ph	H
229	CH ₂ CH ₂ (4-OLau-2-Pyr)	6-Ph	H
230	CH ₂ CH ₂ (4-OLau-2-Pyr)	4-OPh	H

231	CH ₂ CH ₂ (4-OLau-2-Pyr)	5-OPh	H
232	CH ₂ CH ₂ (4-OLau-2-Pyr)	6-OPh	H
233	CH ₂ CH ₂ (4-OLau-2-Pyr)	3, 4- (CH=CH-CH=CH) -	H
234	CH ₂ CH ₂ (4-OLau-2-Pyr)	4, 5- (CH=CH-CH=CH) -	H
235	CH ₂ CH ₂ (4-OLau-2-Pyr)	5, 6- (CH=CH-CH=CH) -	H
236	CH ₂ CH ₂ (4-OH-1-Me-2-Pyr)	4-Hp	H
237	CH ₂ CH ₂ (4-OH-1-Me-2-Pyr)	4-CF ₃	H
238	CH ₂ CH ₂ (4-OH-1-Me-2-Pyr)	4-OH	H
239	CH ₂ CH ₂ (4-OH-1-Me-2-Pyr)	4-OBu	H
240	CH ₂ CH ₂ (4-OH-1-Me-2-Pyr)	6-OBu	H
241	CH ₂ CH ₂ (4-OH-1-Me-2-Pyr)	4-OHp	H
242	CH ₂ CH ₂ (4-OH-1-Me-2-Pyr)	4-OOc	H
243	CH ₂ CH ₂ (4-OH-1-Me-2-Pyr)	4-OCF ₃	H
244	CH ₂ CH ₂ (4-OH-1-Me-2-Pyr)	4-CH ₂ CH=CH ₂	H
245	CH ₂ CH ₂ (4-OH-1-Me-2-Pyr)	4-O-CH ₂ CH=CH ₂	H
246	CH ₂ CH ₂ (4-OH-1-Me-2-Pyr)	4-CH ₂ C≡CH	H
247	CH ₂ CH ₂ (4-OH-1-Me-2-Pyr)	4-O-CH ₂ C≡CH	H
248	CH ₂ CH ₂ (4-OH-1-Me-2-Pyr)	4-Ph	H
249	CH ₂ CH ₂ (4-OH-1-Me-2-Pyr)	5-Ph	H
250	CH ₂ CH ₂ (4-OH-1-Me-2-Pyr)	6-Ph	H
251	CH ₂ CH ₂ (4-OH-1-Me-2-Pyr)	4- (4-Me-Ph)	H
252	CH ₂ CH ₂ (4-OH-1-Me-2-Pyr)	4- (4-OMe-Ph)	H
253	CH ₂ CH ₂ (4-OH-1-Me-2-Pyr)	4- (4-F-Ph)	H
254	CH ₂ CH ₂ (4-OH-1-Me-2-Pyr)	4- (4-Cl-Ph)	H
255	CH ₂ CH ₂ (4-OH-1-Me-2-Pyr)	6- (4-Me-Ph)	H
256	CH ₂ CH ₂ (4-OH-1-Me-2-Pyr)	6- (4-OMe-Ph)	H
257	CH ₂ CH ₂ (4-OH-1-Me-2-Pyr)	6- (4-F-Ph)	H
258	CH ₂ CH ₂ (4-OH-1-Me-2-Pyr)	6- (4-Cl-Ph)	H
259	CH ₂ CH ₂ (4-OH-1-Me-2-Pyr)	4-OPh	H
260	CH ₂ CH ₂ (4-OH-1-Me-2-Pyr)	5-OPh	H
261	CH ₂ CH ₂ (4-OH-1-Me-2-Pyr)	6-OPh	H
262	CH ₂ CH ₂ (4-OH-1-Me-2-Pyr)	4-O- (4-Me-Ph)	H
263	CH ₂ CH ₂ (4-OH-1-Me-2-Pyr)	4-O- (4-OMe-Ph)	H
264	CH ₂ CH ₂ (4-OH-1-Me-2-Pyr)	4-O- (4-F-Ph)	H
265	CH ₂ CH ₂ (4-OH-1-Me-2-Pyr)	4-O- (4-Cl-Ph)	H
266	CH ₂ CH ₂ (4-OH-1-Me-2-Pyr)	6-O- (4-Me-Ph)	H
267	CH ₂ CH ₂ (4-OH-1-Me-2-Pyr)	6-O- (4-OMe-Ph)	H
268	CH ₂ CH ₂ (4-OH-1-Me-2-Pyr)	6-O- (4-F-Ph)	H
269	CH ₂ CH ₂ (4-OH-1-Me-2-Pyr)	6-O- (4-Cl-Ph)	H
270	CH ₂ CH ₂ (4-OH-1-Me-2-Pyr)	3, 4- (CH=CH-CH=CH) -	H
271	CH ₂ CH ₂ (4-OH-1-Me-2-Pyr)	4, 5- (CH=CH-CH=CH) -	H
272	CH ₂ CH ₂ (4-OH-1-Me-2-Pyr)	5, 6- (CH=CH-CH=CH) -	H
273	CH ₂ CH ₂ (4-OCOOc-1-Me-2-Pyr)	4-Hp	H
274	CH ₂ CH ₂ (4-OCOOc-1-Me-2-Pyr)	4-CF ₃	H
275	CH ₂ CH ₂ (4-OCOOc-1-Me-2-Pyr)	4-OH	H
276	CH ₂ CH ₂ (4-OCOOc-1-Me-2-Pyr)	4-OBu	H
277	CH ₂ CH ₂ (4-OCOOc-1-Me-2-Pyr)	4-OOc	H
278	CH ₂ CH ₂ (4-OCOOc-1-Me-2-Pyr)	4-OCF ₃	H
279	CH ₂ CH ₂ (4-OCOOc-1-Me-2-Pyr)	4-CH ₂ CH=CH ₂	H
280	CH ₂ CH ₂ (4-OCOOc-1-Me-2-Pyr)	4-O-CH ₂ CH=CH ₂	H

281	CH ₂ CH ₂ (4-OC00c-1-Me-2-Pyr)	4-CH ₂ C≡CH	H
282	CH ₂ CH ₂ (4-OC00c-1-Me-2-Pyr)	4-O-CH ₂ C≡CH	H
283	CH ₂ CH ₂ (4-OC00c-1-Me-2-Pyr)	4-Ph	H
284	CH ₂ CH ₂ (4-OC00c-1-Me-2-Pyr)	5-Ph	H
285	CH ₂ CH ₂ (4-OC00c-1-Me-2-Pyr)	6-Ph	H
286	CH ₂ CH ₂ (4-OC00c-1-Me-2-Pyr)	4-(4-Me-Ph)	H
287	CH ₂ CH ₂ (4-OC00c-1-Me-2-Pyr)	4-(4-OMe-Ph)	H
288	CH ₂ CH ₂ (4-OC00c-1-Me-2-Pyr)	6-(4-Me-Ph)	H
289	CH ₂ CH ₂ (4-OC00c-1-Me-2-Pyr)	6-(4-OMe-Ph)	H
290	CH ₂ CH ₂ (4-OC00c-1-Me-2-Pyr)	4-OPh	H
291	CH ₂ CH ₂ (4-OC00c-1-Me-2-Pyr)	5-OPh	H
292	CH ₂ CH ₂ (4-OC00c-1-Me-2-Pyr)	6-OPh	H
293	CH ₂ CH ₂ (4-OC00c-1-Me-2-Pyr)	4-O-(4-Me-Ph)	H
294	CH ₂ CH ₂ (4-OC00c-1-Me-2-Pyr)	4-O-(4-OMe-Ph)	H
295	CH ₂ CH ₂ (4-OC00c-1-Me-2-Pyr)	6-O-(4-Me-Ph)	H
296	CH ₂ CH ₂ (4-OC00c-1-Me-2-Pyr)	6-O-(4-OMe-Ph)	H
297	CH ₂ CH ₂ (4-OC00c-1-Me-2-Pyr)	3, 4-(CH=CH-CH=CH)-	H
298	CH ₂ CH ₂ (4-OC00c-1-Me-2-Pyr)	4, 5-(CH=CH-CH=CH)-	H
299	CH ₂ CH ₂ (4-OC00c-1-Me-2-Pyr)	5, 6-(CH=CH-CH=CH)-	H
300	CH ₂ CH ₂ (4-OAc-1-Me-2-Pyr)	4-OH	H
301	CH ₂ CH ₂ (4-OAc-1-Me-2-Pyr)	4-OBu	H
302	CH ₂ CH ₂ (4-OAc-1-Me-2-Pyr)	4-OOc	H
303	CH ₂ CH ₂ (4-OAc-1-Me-2-Pyr)	4-CH ₂ CH=CH ₂	H
304	CH ₂ CH ₂ (4-OAc-1-Me-2-Pyr)	4-O-CH ₂ C≡CH	H
305	CH ₂ CH ₂ (4-OAc-1-Me-2-Pyr)	4-Ph	H
306	CH ₂ CH ₂ (4-OAc-1-Me-2-Pyr)	5-Ph	H
307	CH ₂ CH ₂ (4-OAc-1-Me-2-Pyr)	6-Ph	H
308	CH ₂ CH ₂ (4-OAc-1-Me-2-Pyr)	4-OPh	H
309	CH ₂ CH ₂ (4-OAc-1-Me-2-Pyr)	5-OPh	H
310	CH ₂ CH ₂ (4-OAc-1-Me-2-Pyr)	6-OPh	H
311	CH ₂ CH ₂ (4-OAc-1-Me-2-Pyr)	3, 4-(CH=CH-CH=CH)-	H
312	CH ₂ CH ₂ (4-OAc-1-Me-2-Pyr)	4, 5-(CH=CH-CH=CH)-	H
314	CH ₂ CH ₂ (4-ODec-1-Me-2-Pyr)	4-Hp	H
315	CH ₂ CH ₂ (4-ODec-1-Me-2-Pyr)	4-CF ₃	H
316	CH ₂ CH ₂ (4-ODec-1-Me-2-Pyr)	4-OBu	H
317	CH ₂ CH ₂ (4-ODec-1-Me-2-Pyr)	4-OOc	H
318	CH ₂ CH ₂ (4-ODec-1-Me-2-Pyr)	4-OCF ₃	H
319	CH ₂ CH ₂ (4-ODec-1-Me-2-Pyr)	4-CH ₂ CH=CH ₂	H
320	CH ₂ CH ₂ (4-ODec-1-Me-2-Pyr)	4-O-CH ₂ CH=CH ₂	H
321	CH ₂ CH ₂ (4-ODec-1-Me-2-Pyr)	4-CH ₂ C≡CH	H
322	CH ₂ CH ₂ (4-ODec-1-Me-2-Pyr)	4-O-CH ₂ C≡CH	H
323	CH ₂ CH ₂ (4-ODec-1-Me-2-Pyr)	4-Ph	H
324	CH ₂ CH ₂ (4-ODec-1-Me-2-Pyr)	5-Ph	H
325	CH ₂ CH ₂ (4-ODec-1-Me-2-Pyr)	6-Ph	H
326	CH ₂ CH ₂ (4-ODec-1-Me-2-Pyr)	4-(4-Me-Ph)	H
327	CH ₂ CH ₂ (4-ODec-1-Me-2-Pyr)	4-(4-OMe-Ph)	H
328	CH ₂ CH ₂ (4-ODec-1-Me-2-Pyr)	6-(4-Me-Ph)	H
329	CH ₂ CH ₂ (4-ODec-1-Me-2-Pyr)	6-(4-OMe-Ph)	H
330	CH ₂ CH ₂ (4-ODec-1-Me-2-Pyr)	4-OPh	H
331	CH ₂ CH ₂ (4-ODec-1-Me-2-Pyr)	5-OPh	H

332	CH ₂ CH ₂ (4-ODec-1-Me-2-Pyr)	6-OPh	H
333	CH ₂ CH ₂ (4-ODec-1-Me-2-Pyr)	4-O- (4-Me-Ph)	H
334	CH ₂ CH ₂ (4-ODec-1-Me-2-Pyr)	4-O- (4-OMe-Ph)	H
335	CH ₂ CH ₂ (4-ODec-1-Me-2-Pyr)	6-O- (4-Me-Ph)	H
336	CH ₂ CH ₂ (4-ODec-1-Me-2-Pyr)	6-O- (4-OMe-Ph)	H
337	CH ₂ CH ₂ (4-ODec-1-Me-2-Pyr)	3, 4- (CH=CH-CH=CH) -	H
338	CH ₂ CH ₂ (4-ODec-1-Me-2-Pyr)	4, 5- (CH=CH-CH=CH) -	H
339	CH ₂ CH ₂ (4-ODec-1-Me-2-Pyr)	5, 6- (CH=CH-CH=CH) -	H
340	CH ₂ CH ₂ (4-OLau-1-Me-2-Pyr)	4-Hp	H
341	CH ₂ CH ₂ (4-OLau-1-Me-2-Pyr)	4-CF ₃	H
342	CH ₂ CH ₂ (4-OLau-1-Me-2-Pyr)	4-OH	H
343	CH ₂ CH ₂ (4-OLau-1-Me-2-Pyr)	4-OBu	H
344	CH ₂ CH ₂ (4-OLau-1-Me-2-Pyr)	4-OOc	H
345	CH ₂ CH ₂ (4-OLau-1-Me-2-Pyr)	4-OCF ₃	H
346	CH ₂ CH ₂ (4-OLau-1-Me-2-Pyr)	4-CH ₂ CH=CH ₂	H
347	CH ₂ CH ₂ (4-OLau-1-Me-2-Pyr)	4-O-CH ₂ CH=CH ₂	H
348	CH ₂ CH ₂ (4-OLau-1-Me-2-Pyr)	4-CH ₂ C≡CH	H
349	CH ₂ CH ₂ (4-OLau-1-Me-2-Pyr)	4-O-CH ₂ C≡CH	H
350	CH ₂ CH ₂ (4-OLau-1-Me-2-Pyr)	4-Ph	H
351	CH ₂ CH ₂ (4-OLau-1-Me-2-Pyr)	5-Ph	H
352	CH ₂ CH ₂ (4-OLau-1-Me-2-Pyr)	6-Ph	H
353	CH ₂ CH ₂ (4-OLau-1-Me-2-Pyr)	4- (4-Me-Ph)	H
354	CH ₂ CH ₂ (4-OLau-1-Me-2-Pyr)	4- (4-OMe-Ph)	H
355	CH ₂ CH ₂ (4-OLau-1-Me-2-Pyr)	6- (4-Me-Ph)	H
356	CH ₂ CH ₂ (4-OLau-1-Me-2-Pyr)	6- (4-OMe-Ph)	H
357	CH ₂ CH ₂ (4-OLau-1-Me-2-Pyr)	4-OPh	H
358	CH ₂ CH ₂ (4-OLau-1-Me-2-Pyr)	5-OPh	H
359	CH ₂ CH ₂ (4-OLau-1-Me-2-Pyr)	6-OPh	H
360	CH ₂ CH ₂ (4-OLau-1-Me-2-Pyr)	4-O- (4-Me-Ph)	H
361	CH ₂ CH ₂ (4-OLau-1-Me-2-Pyr)	4-O- (4-OMe-Ph)	H
362	CH ₂ CH ₂ (4-OLau-1-Me-2-Pyr)	6-O- (4-Me-Ph)	H
363	CH ₂ CH ₂ (4-OLau-1-Me-2-Pyr)	6-O- (4-OMe-Ph)	H
364	CH ₂ CH ₂ (4-OLau-1-Me-2-Pyr)	3, 4- (CH=CH-CH=CH) -	H
365	CH ₂ CH ₂ (4-OLau-1-Me-2-Pyr)	4, 5- (CH=CH-CH=CH) -	H
366	CH ₂ CH ₂ (4-OLau-1-Me-2-Pyr)	5, 6- (CH=CH-CH=CH) -	H
367	CH ₂ CH ₂ (4-OMyr-1-Me-2-Pyr)	4-OH	H
368	CH ₂ CH ₂ (4-OMyr-1-Me-2-Pyr)	4-OBu	H
369	CH ₂ CH ₂ (4-OMyr-1-Me-2-Pyr)	4-OOc	H
370	CH ₂ CH ₂ (4-OMyr-1-Me-2-Pyr)	4-O-CH ₂ CH=CH ₂	H
371	CH ₂ CH ₂ (4-OMyr-1-Me-2-Pyr)	4-O-CH ₂ C≡CH	H
372	CH ₂ CH ₂ (4-OMyr-1-Me-2-Pyr)	4-Ph	H
373	CH ₂ CH ₂ (4-OMyr-1-Me-2-Pyr)	5-Ph	H
374	CH ₂ CH ₂ (4-OMyr-1-Me-2-Pyr)	6-Ph	H
375	CH ₂ CH ₂ (4-OMyr-1-Me-2-Pyr)	4-OPh	H
376	CH ₂ CH ₂ (4-OMyr-1-Me-2-Pyr)	5-OPh	H
377	CH ₂ CH ₂ (4-OMyr-1-Me-2-Pyr)	6-OPh	H
378	CH ₂ CH ₂ (4-OMyr-1-Me-2-Pyr)	3, 4- (CH=CH-CH=CH) -	H
379	CH ₂ CH ₂ (4-OMyr-1-Me-2-Pyr)	4, 5- (CH=CH-CH=CH) -	H
380	CH ₂ CH ₂ (4-OMyr-1-Me-2-Pyr)	5, 6- (CH=CH-CH=CH) -	H
381	CH ₂ CH ₂ (4-OPal-1-Me-2-Pyr)	4-OH	H

382	CH ₂ CH ₂ (4-OPal-1-Me-2-Pyr)	4-OBu	H
383	CH ₂ CH ₂ (4-OPal-1-Me-2-Pyr)	4-OOc	H
384	CH ₂ CH ₂ (4-OPal-1-Me-2-Pyr)	4-O-CH ₂ CH=CH ₂	H
385	CH ₂ CH ₂ (4-OPal-1-Me-2-Pyr)	4-O-CH ₂ C≡CH	H
386	CH ₂ CH ₂ (4-OPal-1-Me-2-Pyr)	4-Ph	H
387	CH ₂ CH ₂ (4-OPal-1-Me-2-Pyr)	5-Ph	H
388	CH ₂ CH ₂ (4-OPal-1-Me-2-Pyr)	6-Ph	H
389	CH ₂ CH ₂ (4-OPal-1-Me-2-Pyr)	4-OPh	H
390	CH ₂ CH ₂ (4-OPal-1-Me-2-Pyr)	5-OPh	H
391	CH ₂ CH ₂ (4-OPal-1-Me-2-Pyr)	6-OPh	H
392	CH ₂ CH ₂ (4-OPal-1-Me-2-Pyr)	3, 4- (CH=CH-CH=CH) -	H
393	CH ₂ CH ₂ (4-OPal-1-Me-2-Pyr)	4, 5- (CH=CH-CH=CH) -	H
394	CH ₂ CH ₂ (4-OPal-1-Me-2-Pyr)	5, 6- (CH=CH-CH=CH) -	H
395	CH ₂ CH ₂ (4-OSuc-1-Me-2-Pyr)	4-OH	H
396	CH ₂ CH ₂ (4-OSuc-1-Me-2-Pyr)	4-OBu	H
397	CH ₂ CH ₂ (4-OSuc-1-Me-2-Pyr)	4-OOc	H
398	CH ₂ CH ₂ (4-OSuc-1-Me-2-Pyr)	4-O-CH ₂ CH=CH ₂	H
399	CH ₂ CH ₂ (4-OSuc-1-Me-2-Pyr)	4-O-CH ₂ C≡CH	H
400	CH ₂ CH ₂ (4-OSuc-1-Me-2-Pyr)	4-Ph	H
401	CH ₂ CH ₂ (4-OSuc-1-Me-2-Pyr)	5-Ph	H
402	CH ₂ CH ₂ (4-OSuc-1-Me-2-Pyr)	6-Ph	H
403	CH ₂ CH ₂ (4-OSuc-1-Me-2-Pyr)	4-OPh	H
404	CH ₂ CH ₂ (4-OSuc-1-Me-2-Pyr)	5-OPh	H
405	CH ₂ CH ₂ (4-OSuc-1-Me-2-Pyr)	6-OPh	H
406	CH ₂ CH ₂ (4-OSuc-1-Me-2-Pyr)	3, 4- (CH=CH-CH=CH) -	H
407	CH ₂ CH ₂ (4-OSuc-1-Me-2-Pyr)	4, 5- (CH=CH-CH=CH) -	H
408	CH ₂ CH ₂ (4-OSuc-1-Me-2-Pyr)	5, 6- (CH=CH-CH=CH) -	H
409	CH ₂ CH ₂ (4-OCONMe ₂ -1-Me-2-Pyr)	4-OH	H
410	CH ₂ CH ₂ (4-OCONMe ₂ -1-Me-2-Pyr)	4-OBu	H
411	CH ₂ CH ₂ (4-OCONMe ₂ -1-Me-2-Pyr)	4-OOc	H
412	CH ₂ CH ₂ (4-OCONMe ₂ -1-Me-2-Pyr)	4-O-CH ₂ CH=CH ₂	H
413	CH ₂ CH ₂ (4-OCONMe ₂ -1-Me-2-Pyr)	4-O-CH ₂ C≡CH	H
414	CH ₂ CH ₂ (4-OCONMe ₂ -1-Me-2-Pyr)	4-Ph	H
415	CH ₂ CH ₂ (4-OCONMe ₂ -1-Me-2-Pyr)	5-Ph	H
416	CH ₂ CH ₂ (4-OCONMe ₂ -1-Me-2-Pyr)	6-Ph	H
417	CH ₂ CH ₂ (4-OCONMe ₂ -1-Me-2-Pyr)	4-OPh	H
418	CH ₂ CH ₂ (4-OCONMe ₂ -1-Me-2-Pyr)	5-OPh	H
419	CH ₂ CH ₂ (4-OCONMe ₂ -1-Me-2-Pyr)	6-OPh	H
420	CH ₂ CH ₂ (4-OCONMe ₂ -1-Me-2-Pyr)	3, 4- (CH=CH-CH=CH) -	H
421	CH ₂ CH ₂ (4-OCONMe ₂ -1-Me-2-Pyr)	4, 5- (CH=CH-CH=CH) -	H
422	CH ₂ CH ₂ (4-OCONMe ₂ -1-Me-2-Pyr)	5, 6- (CH=CH-CH=CH) -	H
423	CH ₂ (3-Pyr)	4-OH	H
424	CH ₂ (3-Pyr)	4-OBu	H
425	CH ₂ (3-Pyr)	4-OOc	H
426	CH ₂ (3-Pyr)	4-O-CH ₂ CH=CH ₂	H
427	CH ₂ (3-Pyr)	4-O-CH ₂ C≡CH	H
428	CH ₂ (3-Pyr)	4-Ph	H
429	CH ₂ (3-Pyr)	5-Ph	H
430	CH ₂ (3-Pyr)	6-Ph	H
431	CH ₂ (3-Pyr)	4-OPh	H

432	CH ₂ (3-Pyr)	5-OPh	H
433	CH ₂ (3-Pyr)	6-OPh	H
434	CH ₂ (3-Pyr)	3, 4- (CH=CH-CH=CH) -	H
435	CH ₂ (3-Pyr)	4, 5- (CH=CH-CH=CH) -	H
436	CH ₂ (3-Pyr)	5, 6- (CH=CH-CH=CH) -	H
437	CH ₂ (1-Me-3-Pyr)	4-OH	H
438	CH ₂ (1-Me-3-Pyr)	4-OBu	H
439	CH ₂ (1-Me-3-Pyr)	4-OOc	H
440	CH ₂ (1-Me-3-Pyr)	4-O-CH ₂ CH=CH ₂	H
441	CH ₂ (1-Me-3-Pyr)	4-O-CH ₂ C≡CH	H
442	CH ₂ (1-Me-3-Pyr)	4-Ph	H
443	CH ₂ (1-Me-3-Pyr)	5-Ph	H
444	CH ₂ (1-Me-3-Pyr)	6-Ph	H
445	CH ₂ (1-Me-3-Pyr)	4-OPh	H
446	CH ₂ (1-Me-3-Pyr)	5-OPh	H
447	CH ₂ (1-Me-3-Pyr)	6-OPh	H
448	CH ₂ (1-Me-3-Pyr)	3, 4- (CH=CH-CH=CH) -	H
449	CH ₂ (1-Me-3-Pyr)	4, 5- (CH=CH-CH=CH) -	H
450	CH ₂ (1-Me-3-Pyr)	5, 6- (CH=CH-CH=CH) -	H
451	CH ₂ CH ₂ (2-Pip)	4-OH	H
452	CH ₂ CH ₂ (2-Pip)	4-OBu	H
453	CH ₂ CH ₂ (2-Pip)	4-OOc	H
454	CH ₂ CH ₂ (2-Pip)	4-O-CH ₂ CH=CH ₂	H
455	CH ₂ CH ₂ (2-Pip)	4-O-CH ₂ C≡CH	H
456	CH ₂ CH ₂ (2-Pip)	4-Ph	H
457	CH ₂ CH ₂ (2-Pip)	5-Ph	H
458	CH ₂ CH ₂ (2-Pip)	6-Ph	H
459	CH ₂ CH ₂ (2-Pip)	4-OPh	H
460	CH ₂ CH ₂ (2-Pip)	5-OPh	H
461	CH ₂ CH ₂ (2-Pip)	6-OPh	H
462	CH ₂ CH ₂ (2-Pip)	3, 4- (CH=CH-CH=CH) -	H
463	CH ₂ CH ₂ (2-Pip)	4, 5- (CH=CH-CH=CH) -	H
464	CH ₂ CH ₂ (2-Pip)	5, 6- (CH=CH-CH=CH) -	H
465	CH ₂ CH ₂ (1-Me-2-Pip)	4-OH	H
466	CH ₂ CH ₂ (1-Me-2-Pip)	4-OBu	H
467	CH ₂ CH ₂ (1-Me-2-Pip)	4-OOc	H
468	CH ₂ CH ₂ (1-Me-2-Pip)	4-O-CH ₂ CH=CH ₂	H
469	CH ₂ CH ₂ (1-Me-2-Pip)	4-O-CH ₂ C≡CH	H
470	CH ₂ CH ₂ (1-Me-2-Pip)	4-Ph	H
471	CH ₂ CH ₂ (1-Me-2-Pip)	5-Ph	H
472	CH ₂ CH ₂ (1-Me-2-Pip)	6-Ph	H
473	CH ₂ CH ₂ (1-Me-2-Pip)	4-OPh	H
474	CH ₂ CH ₂ (1-Me-2-Pip)	5-OPh	H
475	CH ₂ CH ₂ (1-Me-2-Pip)	6-OPh	H
476	CH ₂ CH ₂ (1-Me-2-Pip)	3, 4- (CH=CH-CH=CH) -	H
477	CH ₂ CH ₂ (1-Me-2-Pip)	4, 5- (CH=CH-CH=CH) -	H
478	CH ₂ CH ₂ (1-Me-2-Pip)	5, 6- (CH=CH-CH=CH) -	H
479	CH ₂ (3-Pip)	4-OH	H
480	CH ₂ (3-Pip)	4-OBu	H
481	CH ₂ (3-Pip)	4-OOc	H

482	CH ₂ (3-Pip)	4-O-CH ₂ CH=CH ₂	H
483	CH ₂ (3-Pip)	4-O-CH ₂ C≡CH	H
484	CH ₂ (3-Pip)	4-Ph	H
485	CH ₂ (3-Pip)	5-Ph	H
486	CH ₂ (3-Pip)	6-Ph	H
487	CH ₂ (3-Pip)	4-OPh	H
4 8 8	CH ₂ (3-Pip)	5-OPh	H
489	CH ₂ (3-Pip)	6-OPh	H
490	CH ₂ (3-Pip)	3, 4-(CH=CH-CH=CH)-	H
491	CH ₂ (3-Pip)	4, 5-(CH=CH-CH=CH)-	H
492	CH ₂ (3-Pip)	5, 6-(CH=CH-CH=CH)-	H
493	CH ₂ (1-Me-3-Pip)	4-OH	H
494	CH ₂ (1-Me-3-Pip)	4-OBu	H
495	CH ₂ (1-Me-3-Pip)	4-OOc	H
496	CH ₂ (1-Me-3-Pip)	4-O-CH ₂ CH=CH ₂	H
497	CH ₂ (1-Me-3-Pip)	4-O-CH ₂ C≡CH	H
498	CH ₂ (1-Me-3-Pip)	4-Ph	H
499	CH ₂ (1-Me-3-Pip)	5-Ph	H
500	CH ₂ (1-Me-3-Pip)	6-Ph	H
501	CH ₂ (1-Me-3-Pip)	4-OPh	H
502	CH ₂ (1-Me-3-Pip)	5-OPh	H
503	CH ₂ (1-Me-3-Pip)	6-OPh	H
504	CH ₂ (1-Me-3-Pip)	3, 4-(CH=CH-CH=CH)-	H
505	CH ₂ (1-Me-3-Pip)	4, 5-(CH=CH-CH=CH)-	H
506	CH ₂ (1-Me-3-Pip)	5, 6-(CH=CH-CH=CH)-	H
507	CH ₂ CH ₂ NH ₂	4-Oc	3-OMe
508	CH ₂ CH ₂ NH ₂	4-CF ₃	3-OMe
509	CH ₂ CH ₂ NH ₂	4-OH	3-OMe
510	CH ₂ CH ₂ NH ₂	4-OBu	3-OMe
511	CH ₂ CH ₂ NH ₂	4-OHp	3-OMe
512	CH ₂ CH ₂ NH ₂	4-OOc	3-OMe
513	CH ₂ CH ₂ NH ₂	4-OCF ₃	3-OMe
514	CH ₂ CH ₂ NH ₂	4-CH ₂ CH=CH ₂	3-OMe
515	CH ₂ CH ₂ NH ₂	4-O-CH ₂ CH=CH ₂	3-OMe
517	CH ₂ CH ₂ NH ₂	4-O-CH ₂ C≡CH	3-OMe
518	CH ₂ CH ₂ NH ₂	4-Ph	3-OMe
519	CH ₂ CH ₂ NH ₂	5-Ph	3-OMe
520	CH ₂ CH ₂ NH ₂	6-Ph	3-OMe
521	CH ₂ CH ₂ NH ₂	4-(4-Me-Ph)	3-OMe
522	CH ₂ CH ₂ NH ₂	4-(4-OMe-Ph)	3-OMe
523	CH ₂ CH ₂ NH ₂	4-(4-F-Ph)	3-OMe
524	CH ₂ CH ₂ NH ₂	4-(4-Cl-Ph)	3-OMe
525	CH ₂ CH ₂ NH ₂	6-(4-Me-Ph)	3-OMe
526	CH ₂ CH ₂ NH ₂	6-(4-OMe-Ph)	3-OMe
527	CH ₂ CH ₂ NH ₂	6-(4-F-Ph)	3-OMe
528	CH ₂ CH ₂ NH ₂	6-(4-Cl-Ph)	3-OMe
529	CH ₂ CH ₂ NH ₂	4-OPh	3-OMe
530	CH ₂ CH ₂ NH ₂	5-OPh	3-OMe
531	CH ₂ CH ₂ NH ₂	6-OPh	3-OMe
532	CH ₂ CH ₂ NH ₂	4-O-(4-Me-Ph)	3-OMe

533	CH ₂ CH ₂ NH ₂	4-O- (4-OMe-Ph)	3-OMe
534	CH ₂ CH ₂ NH ₂	4-O- (4-F-Ph)	3-OMe
535	CH ₂ CH ₂ NH ₂	4-O- (4-Cl-Ph)	3-OMe
536	CH ₂ CH ₂ NH ₂	6-O- (4-Me-Ph)	3-OMe
537	CH ₂ CH ₂ NH ₂	6-O- (4-OMe-Ph)	3-OMe
538	CH ₂ CH ₂ NH ₂	6-O- (4-F-Ph)	3-OMe
539	CH ₂ CH ₂ NH ₂	6-O- (4-Cl-Ph)	3-OMe
540	CH ₂ CH ₂ NH ₂	3, 4- (CH=CH-CH=CH) -	3-OMe
541	CH ₂ CH ₂ NH ₂	4, 5- (CH=CH-CH=CH) -	3-OMe
542	CH ₂ CH ₂ NH ₂	5, 6- (CH=CH-CH=CH) -	3-OMe
543	CH ₂ CH ₂ NHMe	4-OH	3-OMe
544	CH ₂ CH ₂ NHMe	4-OBu	3-OMe
546	CH ₂ CH ₂ NHMe	4-CH ₂ CH=CH ₂	3-OMe
547	CH ₂ CH ₂ NHMe	4-O-CH ₂ CH=CH ₂	3-OMe
548	CH ₂ CH ₂ NHMe	4-CH ₂ C≡CH	3-OMe
549	CH ₂ CH ₂ NHMe	4-O-CH ₂ C≡CH	3-OMe
550	CH ₂ CH ₂ NHMe	4-Ph	3-OMe
551	CH ₂ CH ₂ NHMe	5-Ph	3-OMe
552	CH ₂ CH ₂ NHMe	6-Ph	3-OMe
553	CH ₂ CH ₂ NHMe	4-OPh	3-OMe
554	CH ₂ CH ₂ NHMe	5-OPh	3-OMe
555	CH ₂ CH ₂ NHMe	6-OPh	3-OMe
556	CH ₂ CH ₂ NHMe	3, 4- (CH=CH-CH=CH) -	3-OMe
557	CH ₂ CH ₂ NHMe	4, 5- (CH=CH-CH=CH) -	3-OMe
558	CH ₂ CH ₂ NHMe	5, 6- (CH=CH-CH=CH) -	3-OMe
559	CH ₂ CH ₂ NMe ₂	4-Hp	3-OMe
560	CH ₂ CH ₂ NMe ₂	4-CF ₃	3-OMe
561	CH ₂ CH ₂ NMe ₂	4-OH	3-OMe
562	CH ₂ CH ₂ NMe ₂	4-OBu	3-OMe
563	CH ₂ CH ₂ NMe ₂	6-OBu	3-OMe
564	CH ₂ CH ₂ NMe ₂	4-OHp	3-OMe
565	CH ₂ CH ₂ NMe ₂	4-OOc	3-OMe
566	CH ₂ CH ₂ NMe ₂	4-OCF ₃	3-OMe
567	CH ₂ CH ₂ NMe ₂	4-CH ₂ CH=CH ₂	3-OMe
568	CH ₂ CH ₂ NMe ₂	4-O-CH ₂ CH=CH ₂	3-OMe
569	CH ₂ CH ₂ NMe ₂	4-CH ₂ C≡CH	3-OMe
570	CH ₂ CH ₂ NMe ₂	4-O-CH ₂ C≡CH	3-OMe
571	CH ₂ CH ₂ NMe ₂	4-Ph	3-OMe
572	CH ₂ CH ₂ NMe ₂	5-Ph	3-OMe
573	CH ₂ CH ₂ NMe ₂	6-Ph	3-OMe
574	CH ₂ CH ₂ NMe ₂	4- (4-Me-Ph)	3-OMe
575	CH ₂ CH ₂ NMe ₂	4- (4-OMe-Ph)	3-OMe
576	CH ₂ CH ₂ NMe ₂	4- (4-F-Ph)	3-OMe
577	CH ₂ CH ₂ NMe ₂	4- (4-Cl-Ph)	3-OMe
578	CH ₂ CH ₂ NMe ₂	6- (4-Me-Ph)	3-OMe
579	CH ₂ CH ₂ NMe ₂	6- (4-OMe-Ph)	3-OMe
580	CH ₂ CH ₂ NMe ₂	6- (4-F-Ph)	3-OMe
581	CH ₂ CH ₂ NMe ₂	6- (4-Cl-Ph)	3-OMe
582	CH ₂ CH ₂ NMe ₂	4-OPh	3-OMe
583	CH ₂ CH ₂ NMe ₂	5-OPh	3-OMe

584	CH ₂ CH ₂ NMe ₂	6-OPh	3-OMe
585	CH ₂ CH ₂ NMe ₂	4-O-(4-Me-Ph)	3-OMe
586	CH ₂ CH ₂ NMe ₂	4-O-(4-OMe-Ph)	3-OMe
587	CH ₂ CH ₂ NMe ₂	4-O-(4-F-Ph)	3-OMe
588	CH ₂ CH ₂ NMe ₂	4-O-(4-Cl-Ph)	3-OMe
589	CH ₂ CH ₂ NMe ₂	6-O-(4-Me-Ph)	3-OMe
590	CH ₂ CH ₂ NMe ₂	6-O-(4-OMe-Ph)	3-OMe
591	CH ₂ CH ₂ NMe ₂	6-O-(4-F-Ph)	3-OMe
592	CH ₂ CH ₂ NMe ₂	6-O-(4-Cl-Ph)	3-OMe
593	CH ₂ CH ₂ NMe ₂	3, 4-(CH=CH-CH=CH)-	3-OMe
594	CH ₂ CH ₂ NMe ₂	4, 5-(CH=CH-CH=CH)-	3-OMe
595	CH ₂ CH ₂ NMe ₂	5, 6-(CH=CH-CH=CH)-	3-OMe
596	CH ₂ CH ₂ NMeEt	4-OH	3-OMe
597	CH ₂ CH ₂ NMeEt	4-OBu	3-OMe
598	CH ₂ CH ₂ NMeEt	4-OOc	3-OMe
599	CH ₂ CH ₂ NMeEt	4-CH ₂ CH=CH ₂	3-OMe
600	CH ₂ CH ₂ NMeEt	4-O-CH ₂ CH=CH ₂	3-OMe
601	CH ₂ CH ₂ NMeEt	4-CH ₂ C≡CH	3-OMe
602	CH ₂ CH ₂ NMeEt	4-O-CH ₂ C≡CH	3-OMe
603	CH ₂ CH ₂ NMeEt	4-Ph	3-OMe
604	CH ₂ CH ₂ NMeEt	5-Ph	3-OMe
605	CH ₂ CH ₂ NMeEt	6-Ph	3-OMe
606	CH ₂ CH ₂ NMeEt	4-OPh	3-OMe
607	CH ₂ CH ₂ NMeEt	5-OPh	3-OMe
608	CH ₂ CH ₂ NMeEt	6-OPh	3-OMe
609	CH ₂ CH ₂ NMeEt	3, 4-(CH=CH-CH=CH)-	3-OMe
610	CH ₂ CH ₂ NMeEt	4, 5-(CH=CH-CH=CH)-	3-OMe
611	CH ₂ CH ₂ NMeEt	5, 6-(CH=CH-CH=CH)-	3-OMe
612	CH ₂ CH ₂ (2-Pyr)	4-Hp	3-OMe
613	CH ₂ CH ₂ (2-Pyr)	4-CF ₃	3-OMe
614	CH ₂ CH ₂ (2-Pyr)	4-OH	3-OMe
615	CH ₂ CH ₂ (2-Pyr)	4-OBu	3-OMe
616	CH ₂ CH ₂ (2-Pyr)	6-OBu	3-OMe
617	CH ₂ CH ₂ (2-Pyr)	4-OHp	3-OMe
618	CH ₂ CH ₂ (2-Pyr)	4-OOc	3-OMe
619	CH ₂ CH ₂ (2-Pyr)	4-OCF ₃	3-OMe
620	CH ₂ CH ₂ (2-Pyr)	4-CH ₂ CH=CH ₂	3-OMe
621	CH ₂ CH ₂ (2-Pyr)	4-O-CH ₂ CH=CH ₂	3-OMe
622	CH ₂ CH ₂ (2-Pyr)	4-CH ₂ C≡CH	3-OMe
623	CH ₂ CH ₂ (2-Pyr)	4-O-CH ₂ C≡CH	3-OMe
624	CH ₂ CH ₂ (2-Pyr)	4-Ph	3-OMe
625	CH ₂ CH ₂ (2-Pyr)	5-Ph	3-OMe
626	CH ₂ CH ₂ (2-Pyr)	6-Ph	3-OMe
627	CH ₂ CH ₂ (2-Pyr)	4-(4-Me-Ph)	3-OMe
628	CH ₂ CH ₂ (2-Pyr)	4-(4-OMe-Ph)	3-OMe
629	CH ₂ CH ₂ (2-Pyr)	4-(4-F-Ph)	3-OMe
630	CH ₂ CH ₂ (2-Pyr)	4-(4-Cl-Ph)	3-OMe
631	CH ₂ CH ₂ (2-Pyr)	6-(4-Me-Ph)	3-OMe
632	CH ₂ CH ₂ (2-Pyr)	6-(4-OMe-Ph)	3-OMe
633	CH ₂ CH ₂ (2-Pyr)	6-(4-F-Ph)	3-OMe

634	CH ₂ CH ₂ (2-Pyr)	6- (4-Cl-Ph)	3-OMe
635	CH ₂ CH ₂ (2-Pyr)	4-OPh	3-OMe
636	CH ₂ CH ₂ (2-Pyr)	5-OPh	3-OMe
637	CH ₂ CH ₂ (2-Pyr)	6-OPh	3-OMe
638	CH ₂ CH ₂ (2-Pyr)	4-O- (4-Me-Ph)	3-OMe
639	CH ₂ CH ₂ (2-Pyr)	4-O- (4-OMe-Ph)	3-OMe
640	CH ₂ CH ₂ (2-Pyr)	4-O- (4-F-Ph)	3-OMe
641	CH ₂ CH ₂ (2-Pyr)	4-O- (4-Cl-Ph)	3-OMe
642	CH ₂ CH ₂ (2-Pyr)	6-O- (4-Me-Ph)	3-OMe
643	CH ₂ CH ₂ (2-Pyr)	6-O- (4-OMe-Ph)	3-OMe
644	CH ₂ CH ₂ (2-Pyr)	6-O- (4-F-Ph)	3-OMe
645	CH ₂ CH ₂ (2-Pyr)	6-O- (4-Cl-Ph)	3-OMe
646	CH ₂ CH ₂ (2-Pyr)	3, 4- (CH=CH-CH=CH) -	3-OMe
647	CH ₂ CH ₂ (2-Pyr)	4, 5- (CH=CH-CH=CH) -	3-OMe
648	CH ₂ CH ₂ (2-Pyr)	5, 6- (CH=CH-CH=CH) -	3-OMe
649	CH ₂ CH ₂ (1-Me-2-Pyr)	4-Hp	3-OMe
650	CH ₂ CH ₂ (1-Me-2-Pyr)	4-CF ₃	3-OMe
651	CH ₂ CH ₂ (1-Me-2-Pyr)	4-OH	3-OMe
652	CH ₂ CH ₂ (1-Me-2-Pyr)	4-OBu	3-OMe
653	CH ₂ CH ₂ (1-Me-2-Pyr)	6-OBu	3-OMe
654	CH ₂ CH ₂ (1-Me-2-Pyr)	4-OHp	3-OMe
655	CH ₂ CH ₂ (1-Me-2-Pyr)	4-OOc	3-OMe
656	CH ₂ CH ₂ (1-Me-2-Pyr)	4-OCF ₃	3-OMe
657	CH ₂ CH ₂ (1-Me-2-Pyr)	4-CH ₂ CH=CH ₂	3-OMe
658	CH ₂ CH ₂ (1-Me-2-Pyr)	4-O-CH ₂ CH=CH ₂	3-OMe
659	CH ₂ CH ₂ (1-Me-2-Pyr)	4-CH ₂ C≡CH	3-OMe
660	CH ₂ CH ₂ (1-Me-2-Pyr)	4-O-CH ₂ C≡CH	3-OMe
661	CH ₂ CH ₂ (1-Me-2-Pyr)	4-Ph	3-OMe
662	CH ₂ CH ₂ (1-Me-2-Pyr)	5-Ph	3-OMe
663	CH ₂ CH ₂ (1-Me-2-Pyr)	6-Ph	3-OMe
664	CH ₂ CH ₂ (1-Me-2-Pyr)	4- (4-Me-Ph)	3-OMe
665	CH ₂ CH ₂ (1-Me-2-Pyr)	4- (4-OMe-Ph)	3-OMe
666	CH ₂ CH ₂ (1-Me-2-Pyr)	4- (4-F-Ph)	3-OMe
667	CH ₂ CH ₂ (1-Me-2-Pyr)	4- (4-Cl-Ph)	3-OMe
668	CH ₂ CH ₂ (1-Me-2-Pyr)	6- (4-Me-Ph)	3-OMe
669	CH ₂ CH ₂ (1-Me-2-Pyr)	6- (4-OMe-Ph)	3-OMe
670	CH ₂ CH ₂ (1-Me-2-Pyr)	6- (4-F-Ph)	3-OMe
671	CH ₂ CH ₂ (1-Me-2-Pyr)	6- (4-Cl-Ph)	3-OMe
672	CH ₂ CH ₂ (1-Me-2-Pyr)	4-OPh	3-OMe
673	CH ₂ CH ₂ (1-Me-2-Pyr)	5-OPh	3-OMe
674	CH ₂ CH ₂ (1-Me-2-Pyr)	6-OPh	3-OMe
675	CH ₂ CH ₂ (1-Me-2-Pyr)	4-O- (4-Me-Ph)	3-OMe
676	CH ₂ CH ₂ (1-Me-2-Pyr)	4-O- (4-OMe-Ph)	3-OMe
677	CH ₂ CH ₂ (1-Me-2-Pyr)	4-O- (4-F-Ph)	3-OMe
678	CH ₂ CH ₂ (1-Me-2-Pyr)	4-O- (4-Cl-Ph)	3-OMe
679	CH ₂ CH ₂ (1-Me-2-Pyr)	6-O- (4-Me-Ph)	3-OMe
680	CH ₂ CH ₂ (1-Me-2-Pyr)	6-O- (4-OMe-Ph)	3-OMe
681	CH ₂ CH ₂ (1-Me-2-Pyr)	6-O- (4-F-Ph)	3-OMe
682	CH ₂ CH ₂ (1-Me-2-Pyr)	6-O- (4-Cl-Ph)	3-OMe
683	CH ₂ CH ₂ (1-Me-2-Pyr)	3, 4- (CH=CH-CH=CH) -	3-OMe

684	CH ₂ CH ₂ (1-Me-2-Pyr)	4, 5- (CH=CH-CH=CH) -	3-OMe
685	CH ₂ CH ₂ (1-Me-2-Pyr)	5, 6- (CH=CH-CH=CH) -	3-OMe
686	CH ₂ CH ₂ (4-OH-2-Pyr)	4-OH	3-OMe
687	CH ₂ CH ₂ (4-OH-2-Pyr)	4-OBu	3-OMe
688	CH ₂ CH ₂ (4-OH-2-Pyr)	4-OOc	3-OMe
689	CH ₂ CH ₂ (4-OH-2-Pyr)	4-O-CH ₂ CH=CH ₂	3-OMe
690	CH ₂ CH ₂ (4-OH-2-Pyr)	4-O-CH ₂ C≡CH	3-OMe
691	CH ₂ CH ₂ (4-OH-2-Pyr)	4-Ph	3-OMe
692	CH ₂ CH ₂ (4-OH-2-Pyr)	5-Ph	3-OMe
693	CH ₂ CH ₂ (4-OH-2-Pyr)	6-Ph	3-OMe
694	CH ₂ CH ₂ (4-OH-2-Pyr)	4-OPh	3-OMe
695	CH ₂ CH ₂ (4-OH-2-Pyr)	5-OPh	3-OMe
696	CH ₂ CH ₂ (4-OH-2-Pyr)	6-OPh	3-OMe
697	CH ₂ CH ₂ (4-OH-2-Pyr)	3, 4- (CH=CH-CH=CH) -	3-OMe
698	CH ₂ CH ₂ (4-OH-2-Pyr)	4, 5- (CH=CH-CH=CH) -	3-OMe
699	CH ₂ CH ₂ (4-OH-2-Pyr)	5, 6- (CH=CH-CH=CH) -	3-OMe
700	CH ₂ CH ₂ (4-OCOOc-2-Pyr)	4-OH	3-OMe
701	CH ₂ CH ₂ (4-OCOOc-2-Pyr)	4-OBu	3-OMe
702	CH ₂ CH ₂ (4-OCOOc-2-Pyr)	4-OOc	3-OMe
703	CH ₂ CH ₂ (4-OCOOc-2-Pyr)	4-O-CH ₂ CH=CH ₂	3-OMe
704	CH ₂ CH ₂ (4-OCOOc-2-Pyr)	4-O-CH ₂ C≡CH	3-OMe
705	CH ₂ CH ₂ (4-OCOOc-2-Pyr)	4-Ph	3-OMe
706	CH ₂ CH ₂ (4-OCOOc-2-Pyr)	5-Ph	3-OMe
707	CH ₂ CH ₂ (4-OCOOc-2-Pyr)	6-Ph	3-OMe
708	CH ₂ CH ₂ (4-OCOOc-2-Pyr)	4-OPh	3-OMe
709	CH ₂ CH ₂ (4-OCOOc-2-Pyr)	5-OPh	3-OMe
710	CH ₂ CH ₂ (4-OCOOc-2-Pyr)	6-OPh	3-OMe
711	CH ₂ CH ₂ (4-OCOOc-2-Pyr)	3, 4- (CH=CH-CH=CH) -	3-OMe
712	CH ₂ CH ₂ (4-OCOOc-2-Pyr)	4, 5- (CH=CH-CH=CH) -	3-OMe
713	CH ₂ CH ₂ (4-OCOOc-2-Pyr)	5, 6- (CH=CH-CH=CH) -	3-OMe
714	CH ₂ CH ₂ (4-ODec-2-Pyr)	4-OH	3-OMe
715	CH ₂ CH ₂ (4-ODec-2-Pyr)	4-OBu	3-OMe
716	CH ₂ CH ₂ (4-ODec-2-Pyr)	4-OOc	3-OMe
717	CH ₂ CH ₂ (4-ODec-2-Pyr)	4-O-CH ₂ CH=CH ₂	3-OMe
718	CH ₂ CH ₂ (4-ODec-2-Pyr)	4-O-CH ₂ C≡CH	3-OMe
719	CH ₂ CH ₂ (4-ODec-2-Pyr)	4-Ph	3-OMe
720	CH ₂ CH ₂ (4-ODec-2-Pyr)	5-Ph	3-OMe
721	CH ₂ CH ₂ (4-ODec-2-Pyr)	6-Ph	3-OMe
722	CH ₂ CH ₂ (4-ODec-2-Pyr)	4-OPh	3-OMe
723	CH ₂ CH ₂ (4-ODec-2-Pyr)	5-OPh	3-OMe
724	CH ₂ CH ₂ (4-ODec-2-Pyr)	6-OPh	3-OMe
725	CH ₂ CH ₂ (4-ODec-2-Pyr)	3, 4- (CH=CH-CH=CH) -	3-OMe
726	CH ₂ CH ₂ (4-ODec-2-Pyr)	4, 5- (CH=CH-CH=CH) -	3-OMe
727	CH ₂ CH ₂ (4-ODec-2-Pyr)	5, 6- (CH=CH-CH=CH) -	3-OMe
728	CH ₂ CH ₂ (4-OLau-2-Pyr)	4-OH	3-OMe
729	CH ₂ CH ₂ (4-OLau-2-Pyr)	4-OBu	3-OMe
730	CH ₂ CH ₂ (4-OLau-2-Pyr)	4-OOc	3-OMe
731	CH ₂ CH ₂ (4-OLau-2-Pyr)	4-O-CH ₂ CH=CH ₂	3-OMe
732	CH ₂ CH ₂ (4-OLau-2-Pyr)	4-O-CH ₂ C≡CH	3-OMe
733	CH ₂ CH ₂ (4-OLau-2-Pyr)	4-Ph	3-OMe

734	CH ₂ CH ₂ (4-OLau-2-Pyr)	5-Ph	3-OMe
735	CH ₂ CH ₂ (4-OLau-2-Pyr)	6-Ph	3-OMe
736	CH ₂ CH ₂ (4-OLau-2-Pyr)	4-OPh	3-OMe
737	CH ₂ CH ₂ (4-OLau-2-Pyr)	5-OPh	3-OMe
738	CH ₂ CH ₂ (4-OLau-2-Pyr)	6-OPh	3-OMe
739	CH ₂ CH ₂ (4-OLau-2-Pyr)	3, 4-(CH=CH-CH=CH)-	3-OMe
740	CH ₂ CH ₂ (4-OLau-2-Pyr)	4, 5-(CH=CH-CH=CH)-	3-OMe
741	CH ₂ CH ₂ (4-OLau-2-Pyr)	5, 6-(CH=CH-CH=CH)-	3-OMe
742	CH ₂ CH ₂ (4-OH-1-Me-2-Pyr)	4-Hp	3-OMe
743	CH ₂ CH ₂ (4-OH-1-Me-2-Pyr)	4-CF ₃	3-OMe
744	CH ₂ CH ₂ (4-OH-1-Me-2-Pyr)	4-OH	3-OMe
745	CH ₂ CH ₂ (4-OH-1-Me-2-Pyr)	4-OBu	3-OMe
746	CH ₂ CH ₂ (4-OH-1-Me-2-Pyr)	4-OBu	3-OMe
747	CH ₂ CH ₂ (4-OH-1-Me-2-Pyr)	4-OPh	3-OMe
748	CH ₂ CH ₂ (4-OH-1-Me-2-Pyr)	4-OOc	3-OMe
749	CH ₂ CH ₂ (4-OH-1-Me-2-Pyr)	4-OCF ₃	3-OMe
750	CH ₂ CH ₂ (4-OH-1-Me-2-Pyr)	4-CH ₂ CH=CH ₂	3-OMe
751	CH ₂ CH ₂ (4-OH-1-Me-2-Pyr)	4-O-CH ₂ CH=CH ₂	3-OMe
752	CH ₂ CH ₂ (4-OH-1-Me-2-Pyr)	4-CH ₂ C≡CH	3-OMe
753	CH ₂ CH ₂ (4-OH-1-Me-2-Pyr)	4-O-CH ₂ C≡CH	3-OMe
754	CH ₂ CH ₂ (4-OH-1-Me-2-Pyr)	4-Ph	3-OMe
755	CH ₂ CH ₂ (4-OH-1-Me-2-Pyr)	5-Ph	3-OMe
756	CH ₂ CH ₂ (4-OH-1-Me-2-Pyr)	6-Ph	3-OMe
757	CH ₂ CH ₂ (4-OH-1-Me-2-Pyr)	4-(4-Me-Ph)	3-OMe
758	CH ₂ CH ₂ (4-OH-1-Me-2-Pyr)	4-(4-OMe-Ph)	3-OMe
759	CH ₂ CH ₂ (4-OH-1-Me-2-Pyr)	4-(4-F-Ph)	3-OMe
760	CH ₂ CH ₂ (4-OH-1-Me-2-Pyr)	4-(4-Cl-Ph)	3-OMe
761	CH ₂ CH ₂ (4-OH-1-Me-2-Pyr)	6-(4-Me-Ph)	3-OMe
762	CH ₂ CH ₂ (4-OH-1-Me-2-Pyr)	6-(4-OMe-Ph)	3-OMe
763	CH ₂ CH ₂ (4-OH-1-Me-2-Pyr)	6-(4-F-Ph)	3-OMe
764	CH ₂ CH ₂ (4-OH-1-Me-2-Pyr)	6-(4-Cl-Ph)	3-OMe
765	CH ₂ CH ₂ (4-OH-1-Me-2-Pyr)	4-OPh	3-OMe
766	CH ₂ CH ₂ (4-OH-1-Me-2-Pyr)	5-OPh	3-OMe
767	CH ₂ CH ₂ (4-OH-1-Me-2-Pyr)	6-OPh	3-OMe
768	CH ₂ CH ₂ (4-OH-1-Me-2-Pyr)	4-O-(4-Me-Ph)	3-OMe
769	CH ₂ CH ₂ (4-OH-1-Me-2-Pyr)	4-O-(4-OMe-Ph)	3-OMe
770	CH ₂ CH ₂ (4-OH-1-Me-2-Pyr)	4-O-(4-F-Ph)	3-OMe
771	CH ₂ CH ₂ (4-OH-1-Me-2-Pyr)	4-O-(4-Cl-Ph)	3-OMe
772	CH ₂ CH ₂ (4-OH-1-Me-2-Pyr)	6-O-(4-Me-Ph)	3-OMe
773	CH ₂ CH ₂ (4-OH-1-Me-2-Pyr)	6-O-(4-OMe-Ph)	3-OMe
774	CH ₂ CH ₂ (4-OH-1-Me-2-Pyr)	6-O-(4-F-Ph)	3-OMe
775	CH ₂ CH ₂ (4-OH-1-Me-2-Pyr)	6-O-(4-Cl-Ph)	3-OMe
776	CH ₂ CH ₂ (4-OH-1-Me-2-Pyr)	3, 4-(CH=CH-CH=CH)-	3-OMe
777	CH ₂ CH ₂ (4-OH-1-Me-2-Pyr)	4, 5-(CH=CH-CH=CH)-	3-OMe
778	CH ₂ CH ₂ (4-OH-1-Me-2-Pyr)	5, 6-(CH=CH-CH=CH)-	3-OMe
779	CH ₂ CH ₂ (4-OCOOc-1-Me-2-Pyr)	4-Hp	3-OMe
780	CH ₂ CH ₂ (4-OCOOc-1-Me-2-Pyr)	4-CF ₃	3-OMe
781	CH ₂ CH ₂ (4-OCOOc-1-Me-2-Pyr)	4-OH	3-OMe
782	CH ₂ CH ₂ (4-OCOOc-1-Me-2-Pyr)	4-OBu	3-OMe
783	CH ₂ CH ₂ (4-OCOOc-1-Me-2-Pyr)	4-OOc	3-OMe

784	CH ₂ CH ₂ (4-OC00c-1-Me-2-Pyr)	4-OCF ₃	3-OMe
785	CH ₂ CH ₂ (4-OC00c-1-Me-2-Pyr)	4-CH ₂ CH=CH ₂	3-OMe
786	CH ₂ CH ₂ (4-OC00c-1-Me-2-Pyr)	4-O-CH ₂ CH=CH ₂	3-OMe
787	CH ₂ CH ₂ (4-OC00c-1-Me-2-Pyr)	4-CH ₂ C≡CH	3-OMe
788	CH ₂ CH ₂ (4-OC00c-1-Me-2-Pyr)	4-O-CH ₂ C≡CH	3-OMe
789	CH ₂ CH ₂ (4-OC00c-1-Me-2-Pyr)	4-Ph	3-OMe
790	CH ₂ CH ₂ (4-OC00c-1-Me-2-Pyr)	5-Ph	3-OMe
791	CH ₂ CH ₂ (4-OC00c-1-Me-2-Pyr)	6-Ph	3-OMe
792	CH ₂ CH ₂ (4-OC00c-1-Me-2-Pyr)	4-(4-Me-Ph)	3-OMe
793	CH ₂ CH ₂ (4-OC00c-1-Me-2-Pyr)	4-(4-OMe-Ph)	3-OMe
794	CH ₂ CH ₂ (4-OC00c-1-Me-2-Pyr)	6-(4-Me-Ph)	3-OMe
795	CH ₂ CH ₂ (4-OC00c-1-Me-2-Pyr)	6-(4-OMe-Ph)	3-OMe
796	CH ₂ CH ₂ (4-OC00c-1-Me-2-Pyr)	4-OPh	3-OMe
797	CH ₂ CH ₂ (4-OC00c-1-Me-2-Pyr)	5-OPh	3-OMe
798	CH ₂ CH ₂ (4-OC00c-1-Me-2-Pyr)	6-OPh	3-OMe
799	CH ₂ CH ₂ (4-OC00c-1-Me-2-Pyr)	4-O-(4-Me-Ph)	3-OMe
800	CH ₂ CH ₂ (4-OC00c-1-Me-2-Pyr)	4-O-(4-OMe-Ph)	3-OMe
801	CH ₂ CH ₂ (4-OC00c-1-Me-2-Pyr)	6-O-(4-Me-Ph)	3-OMe
802	CH ₂ CH ₂ (4-OC00c-1-Me-2-Pyr)	6-O-(4-OMe-Ph)	3-OMe
803	CH ₂ CH ₂ (4-OC00c-1-Me-2-Pyr)	3, 4-(CH=CH-CH=CH)-	3-OMe
804	CH ₂ CH ₂ (4-OC00c-1-Me-2-Pyr)	4, 5-(CH=CH-CH=CH)-	3-OMe
805	CH ₂ CH ₂ (4-OC00c-1-Me-2-Pyr)	5, 6-(CH=CH-CH=CH)-	3-OMe
806	CH ₂ CH ₂ (4-OAc-1-Me-2-Pyr)	4-OH	3-OMe
807	CH ₂ CH ₂ (4-OAc-1-Me-2-Pyr)	4-OBu	3-OMe
808	CH ₂ CH ₂ (4-OAc-1-Me-2-Pyr)	4-OOc	3-OMe
809	CH ₂ CH ₂ (4-OAc-1-Me-2-Pyr)	4-O-CH ₂ CH=CH ₂	3-OMe
810	CH ₂ CH ₂ (4-OAc-1-Me-2-Pyr)	4-O-CH ₂ C≡CH	3-OMe
811	CH ₂ CH ₂ (4-OAc-1-Me-2-Pyr)	4-Ph	3-OMe
812	CH ₂ CH ₂ (4-OAc-1-Me-2-Pyr)	5-Ph	3-OMe
813	CH ₂ CH ₂ (4-OAc-1-Me-2-Pyr)	6-Ph	3-OMe
814	CH ₂ CH ₂ (4-OAc-1-Me-2-Pyr)	4-OPh	3-OMe
815	CH ₂ CH ₂ (4-OAc-1-Me-2-Pyr)	5-OPh	3-OMe
816	CH ₂ CH ₂ (4-OAc-1-Me-2-Pyr)	6-OPh	3-OMe
817	CH ₂ CH ₂ (4-OAc-1-Me-2-Pyr)	3, 4-(CH=CH-CH=CH)-	3-OMe
818	CH ₂ CH ₂ (4-OAc-1-Me-2-Pyr)	4, 5-(CH=CH-CH=CH)-	3-OMe
819	CH ₂ CH ₂ (4-OAc-1-Me-2-Pyr)	5, 6-(CH=CH-CH=CH)-	3-OMe
820	CH ₂ CH ₂ (4-ODec-1-Me-2-Pyr)	4-Hp	3-OMe
821	CH ₂ CH ₂ (4-ODec-1-Me-2-Pyr)	4-CF ₃	3-OMe
822	CH ₂ CH ₂ (4-ODec-1-Me-2-Pyr)	4-OBu	3-OMe
823	CH ₂ CH ₂ (4-ODec-1-Me-2-Pyr)	4-OOc	3-OMe
824	CH ₂ CH ₂ (4-ODec-1-Me-2-Pyr)	4-OCF ₃	3-OMe
825	CH ₂ CH ₂ (4-ODec-1-Me-2-Pyr)	4-CH ₂ CH=CH ₂	3-OMe
826	CH ₂ CH ₂ (4-ODec-1-Me-2-Pyr)	4-O-CH ₂ CH=CH ₂	3-OMe
827	CH ₂ CH ₂ (4-ODec-1-Me-2-Pyr)	4-CH ₂ C≡CH	3-OMe
828	CH ₂ CH ₂ (4-ODec-1-Me-2-Pyr)	4-O-CH ₂ C≡CH	3-OMe
829	CH ₂ CH ₂ (4-ODec-1-Me-2-Pyr)	4-Ph	3-OMe
830	CH ₂ CH ₂ (4-ODec-1-Me-2-Pyr)	5-Ph	3-OMe
831	CH ₂ CH ₂ (4-ODec-1-Me-2-Pyr)	6-Ph	3-OMe
832	CH ₂ CH ₂ (4-ODec-1-Me-2-Pyr)	4-(4-Me-Ph)	3-OMe
833	CH ₂ CH ₂ (4-ODec-1-Me-2-Pyr)	4-(4-OMe-Ph)	3-OMe

834	CH ₂ CH ₂ (4-ODec-1-Me-2-Pyr)	6-(4-Me-Ph)	3-OMe
835	CH ₂ CH ₂ (4-ODec-1-Me-2-Pyr)	6-(4-OMe-Ph)	3-OMe
836	CH ₂ CH ₂ (4-ODec-1-Me-2-Pyr)	4-OPh	3-OMe
837	CH ₂ CH ₂ (4-ODec-1-Me-2-Pyr)	5-OPh	3-OMe
838	CH ₂ CH ₂ (4-ODec-1-Me-2-Pyr)	6-OPh	3-OMe
839	CH ₂ CH ₂ (4-ODec-1-Me-2-Pyr)	4-O-(4-Me-Ph)	3-OMe
840	CH ₂ CH ₂ (4-ODec-1-Me-2-Pyr)	4-O-(4-OMe-Ph)	3-OMe
841	CH ₂ CH ₂ (4-ODec-1-Me-2-Pyr)	6-O-(4-Me-Ph)	3-OMe
842	CH ₂ CH ₂ (4-ODec-1-Me-2-Pyr)	6-O-(4-OMe-Ph)	3-OMe
843	CH ₂ CH ₂ (4-ODec-1-Me-2-Pyr)	3, 4-(CH=CH-CH=CH)-	3-OMe
844	CH ₂ CH ₂ (4-ODec-1-Me-2-Pyr)	4, 5-(CH=CH-CH=CH)-	3-OMe
845	CH ₂ CH ₂ (4-ODec-1-Me-2-Pyr)	5, 6-(CH=CH-CH=CH)-	3-OMe
846	CH ₂ CH ₂ (4-OLau-1-Me-2-Pyr)	4-Hp	3-OMe
847	CH ₂ CH ₂ (4-OLau-1-Me-2-Pyr)	4-CF ₃	3-OMe
848	CH ₂ CH ₂ (4-OLau-1-Me-2-Pyr)	4-OH	3-OMe
849	CH ₂ CH ₂ (4-OLau-1-Me-2-Pyr)	4-OBu	3-OMe
850	CH ₂ CH ₂ (4-OLau-1-Me-2-Pyr)	4-OOc	3-OMe
851	CH ₂ CH ₂ (4-OLau-1-Me-2-Pyr)	4-OCF ₃	3-OMe
852	CH ₂ CH ₂ (4-OLau-1-Me-2-Pyr)	4-CH ₂ CH=CH ₂	3-OMe
853	CH ₂ CH ₂ (4-OLau-1-Me-2-Pyr)	4-O-CH ₂ CH=CH ₂	3-OMe
854	CH ₂ CH ₂ (4-OLau-1-Me-2-Pyr)	4-CH ₂ C≡CH	3-OMe
855	CH ₂ CH ₂ (4-OLau-1-Me-2-Pyr)	4-O-CH ₂ C≡CH	3-OMe
856	CH ₂ CH ₂ (4-OLau-1-Me-2-Pyr)	4-Ph	3-OMe
857	CH ₂ CH ₂ (4-OLau-1-Me-2-Pyr)	5-Ph	3-OMe
858	CH ₂ CH ₂ (4-OLau-1-Me-2-Pyr)	6-Ph	3-OMe
859	CH ₂ CH ₂ (4-OLau-1-Me-2-Pyr)	4-(4-Me-Ph)	3-OMe
860	CH ₂ CH ₂ (4-OLau-1-Me-2-Pyr)	4-(4-OMe-Ph)	3-OMe
861	CH ₂ CH ₂ (4-OLau-1-Me-2-Pyr)	6-(4-Me-Ph)	3-OMe
862	CH ₂ CH ₂ (4-OLau-1-Me-2-Pyr)	6-(4-OMe-Ph)	3-OMe
863	CH ₂ CH ₂ (4-OLau-1-Me-2-Pyr)	4-OPh	3-OMe
864	CH ₂ CH ₂ (4-OLau-1-Me-2-Pyr)	5-OPh	3-OMe
865	CH ₂ CH ₂ (4-OLau-1-Me-2-Pyr)	6-OPh	3-OMe
866	CH ₂ CH ₂ (4-OLau-1-Me-2-Pyr)	4-O-(4-Me-Ph)	3-OMe
867	CH ₂ CH ₂ (4-OLau-1-Me-2-Pyr)	4-O-(4-OMe-Ph)	3-OMe
868	CH ₂ CH ₂ (4-OLau-1-Me-2-Pyr)	6-O-(4-Me-Ph)	3-OMe
869	CH ₂ CH ₂ (4-OLau-1-Me-2-Pyr)	6-O-(4-OMe-Ph)	3-OMe
870	CH ₂ CH ₂ (4-OLau-1-Me-2-Pyr)	3, 4-(CH=CH-CH=CH)-	3-OMe
871	CH ₂ CH ₂ (4-OLau-1-Me-2-Pyr)	4, 5-(CH=CH-CH=CH)-	3-OMe
872	CH ₂ CH ₂ (4-OLau-1-Me-2-Pyr)	5, 6-(CH=CH-CH=CH)-	3-OMe
873	CH ₂ CH ₂ (4-OMyr-1-Me-2-Pyr)	4-OH	3-OMe
874	CH ₂ CH ₂ (4-OMyr-1-Me-2-Pyr)	4-OBu	3-OMe
875	CH ₂ CH ₂ (4-OMyr-1-Me-2-Pyr)	4-OOc	3-OMe
876	CH ₂ CH ₂ (4-OMyr-1-Me-2-Pyr)	4-O-CH ₂ CH=CH ₂	3-OMe
877	CH ₂ CH ₂ (4-OMyr-1-Me-2-Pyr)	4-O-CH ₂ C≡CH	3-OMe
878	CH ₂ CH ₂ (4-OMyr-1-Me-2-Pyr)	4-Ph	3-OMe
879	CH ₂ CH ₂ (4-OMyr-1-Me-2-Pyr)	5-Ph	3-OMe
880	CH ₂ CH ₂ (4-OMyr-1-Me-2-Pyr)	6-Ph	3-OMe
881	CH ₂ CH ₂ (4-OMyr-1-Me-2-Pyr)	4-OPh	3-OMe
882	CH ₂ CH ₂ (4-OMyr-1-Me-2-Pyr)	5-OPh	3-OMe
883	CH ₂ CH ₂ (4-OMyr-1-Me-2-Pyr)	6-OPh	3-OMe

884	CH ₂ CH ₂ (4-OMyr-1-Me-2-Pyr)	3, 4- (CH=CH-CH=CH) -	3-OMe
885	CH ₂ CH ₂ (4-OMyr-1-Me-2-Pyr)	4, 5- (CH=CH-CH=CH) -	3-OMe
886	CH ₂ CH ₂ (4-OMyr-1-Me-2-Pyr)	5, 6- (CH=CH-CH=CH) -	3-OMe
887	CH ₂ CH ₂ (4-OPal-1-Me-2-Pyr)	4-OH	3-OMe
888	CH ₂ CH ₂ (4-OPal-1-Me-2-Pyr)	4-OBu	3-OMe
889	CH ₂ CH ₂ (4-OPal-1-Me-2-Pyr)	4-OOc	3-OMe
890	CH ₂ CH ₂ (4-OPal-1-Me-2-Pyr)	4-O-CH ₂ CH=CH ₂	3-OMe
891	CH ₂ CH ₂ (4-OPal-1-Me-2-Pyr)	4-O-CH ₂ C≡CH	3-OMe
892	CH ₂ CH ₂ (4-OPal-1-Me-2-Pyr)	4-Ph	3-OMe
893	CH ₂ CH ₂ (4-OPal-1-Me-2-Pyr)	5-Ph	3-OMe
894	CH ₂ CH ₂ (4-OPal-1-Me-2-Pyr)	6-Ph	3-OMe
895	CH ₂ CH ₂ (4-OPal-1-Me-2-Pyr)	4-OPh	3-OMe
896	CH ₂ CH ₂ (4-OPal-1-Me-2-Pyr)	5-OPh	3-OMe
897	CH ₂ CH ₂ (4-OPal-1-Me-2-Pyr)	6-OPh	3-OMe
898	CH ₂ CH ₂ (4-OPal-1-Me-2-Pyr)	3, 4- (CH=CH-CH=CH) -	3-OMe
899	CH ₂ CH ₂ (4-OPal-1-Me-2-Pyr)	4, 5- (CH=CH-CH=CH) -	3-OMe
900	CH ₂ CH ₂ (4-OPal-1-Me-2-Pyr)	5, 6- (CH=CH-CH=CH) -	3-OMe
901	CH ₂ CH ₂ (4-OSuc-1-Me-2-Pyr)	4-OH	3-OMe
902	CH ₂ CH ₂ (4-OSuc-1-Me-2-Pyr)	4-OBu	3-OMe
903	CH ₂ CH ₂ (4-OSuc-1-Me-2-Pyr)	4-OOc	3-OMe
904	CH ₂ CH ₂ (4-OSuc-1-Me-2-Pyr)	4-O-CH ₂ CH=CH ₂	3-OMe
905	CH ₂ CH ₂ (4-OSuc-1-Me-2-Pyr)	4-O-CH ₂ C≡CH	3-OMe
906	CH ₂ CH ₂ (4-OSuc-1-Me-2-Pyr)	4-Ph	3-OMe
907	CH ₂ CH ₂ (4-OSuc-1-Me-2-Pyr)	5-Ph	3-OMe
908	CH ₂ CH ₂ (4-OSuc-1-Me-2-Pyr)	6-Ph	3-OMe
909	CH ₂ CH ₂ (4-OSuc-1-Me-2-Pyr)	4-OPh	3-OMe
910	CH ₂ CH ₂ (4-OSuc-1-Me-2-Pyr)	5-OPh	3-OMe
911	CH ₂ CH ₂ (4-OSuc-1-Me-2-Pyr)	6-OPh	3-OMe
912	CH ₂ CH ₂ (4-OSuc-1-Me-2-Pyr)	3, 4- (CH=CH-CH=CH) -	3-OMe
913	CH ₂ CH ₂ (4-OSuc-1-Me-2-Pyr)	4, 5- (CH=CH-CH=CH) -	3-OMe
914	CH ₂ CH ₂ (4-OSuc-1-Me-2-Pyr)	5, 6- (CH=CH-CH=CH) -	3-OMe
915	CH ₂ CH ₂ (4-OCONMe ₂ -1-Me-2-Pyr)	4-OH	3-OMe
916	CH ₂ CH ₂ (4-OCONMe ₂ -1-Me-2-Pyr)	4-OBu	3-OMe
917	CH ₂ CH ₂ (4-OCONMe ₂ -1-Me-2-Pyr)	4-OOc	3-OMe
918	CH ₂ CH ₂ (4-OCONMe ₂ -1-Me-2-Pyr)	4-O-CH ₂ CH=CH ₂	3-OMe
919	CH ₂ CH ₂ (4-OCONMe ₂ -1-Me-2-Pyr)	4-O-CH ₂ C≡CH	3-OMe
920	CH ₂ CH ₂ (4-OCONMe ₂ -1-Me-2-Pyr)	4-Ph	3-OMe
921	CH ₂ CH ₂ (4-OCONMe ₂ -1-Me-2-Pyr)	5-Ph	3-OMe
922	CH ₂ CH ₂ (4-OCONMe ₂ -1-Me-2-Pyr)	6-Ph	3-OMe
923	CH ₂ CH ₂ (4-OCONMe ₂ -1-Me-2-Pyr)	4-OPh	3-OMe
924	CH ₂ CH ₂ (4-OCONMe ₂ -1-Me-2-Pyr)	5-OPh	3-OMe
925	CH ₂ CH ₂ (4-OCONMe ₂ -1-Me-2-Pyr)	6-OPh	3-OMe
926	CH ₂ CH ₂ (4-OCONMe ₂ -1-Me-2-Pyr)	3, 4- (CH=CH-CH=CH) -	3-OMe
927	CH ₂ CH ₂ (4-OCONMe ₂ -1-Me-2-Pyr)	4, 5- (CH=CH-CH=CH) -	3-OMe
928	CH ₂ CH ₂ (4-OCONMe ₂ -1-Me-2-Pyr)	5, 6- (CH=CH-CH=CH) -	3-OMe
929	CH ₂ (3-Pyr)	4-OH	3-OMe
930	CH ₂ (3-Pyr)	4-OBu	3-OMe
931	CH ₂ (3-Pyr)	4-OOc	3-OMe
932	CH ₂ (3-Pyr)	4-O-CH ₂ CH=CH ₂	3-OMe
933	CH ₂ (3-Pyr)	4-O-CH ₂ C≡CH	3-OMe

934	CH ₂ (3-Pyr)	4-Ph	3-OMe
935	CH ₂ (3-Pyr)	5-Ph	3-OMe
936	CH ₂ (3-Pyr)	6-Ph	3-OMe
937	CH ₂ (3-Pyr)	4-OPh	3-OMe
938	CH ₂ (3-Pyr)	5-OPh	3-OMe
939	CH ₂ (3-Pyr)	6-OPh	3-OMe
940	CH ₂ (3-Pyr)	3, 4-(CH=CH-CH=CH)-	3-OMe
941	CH ₂ (3-Pyr)	4, 5-(CH=CH-CH=CH)-	3-OMe
942	CH ₂ (3-Pyr)	5, 6-(CH=CH-CH=CH)-	3-OMe
943	CH ₂ (1-Me-3-Pyr)	4-OH	3-OMe
944	CH ₂ (1-Me-3-Pyr)	4-OBu	3-OMe
945	CH ₂ (1-Me-3-Pyr)	4-OOc	3-OMe
946	CH ₂ (1-Me-3-Pyr)	4-O-CH ₂ CH=CH ₂	3-OMe
947	CH ₂ (1-Me-3-Pyr)	4-O-CH ₂ C≡CH	3-OMe
948	CH ₂ (1-Me-3-Pyr)	4-Ph	3-OMe
949	CH ₂ (1-Me-3-Pyr)	5-Ph	3-OMe
950	CH ₂ (1-Me-3-Pyr)	6-Ph	3-OMe
951	CH ₂ (1-Me-3-Pyr)	4-OPh	3-OMe
952	CH ₂ (1-Me-3-Pyr)	5-OPh	3-OMe
953	CH ₂ (1-Me-3-Pyr)	6-OPh	3-OMe
954	CH ₂ (1-Me-3-Pyr)	3, 4-(CH=CH-CH=CH)-	3-OMe
955	CH ₂ (1-Me-3-Pyr)	4, 5-(CH=CH-CH=CH)-	3-OMe
956	CH ₂ (1-Me-3-Pyr)	5, 6-(CH=CH-CH=CH)-	3-OMe
957	CH ₂ CH ₂ (2-Pip)	4-OH	3-OMe
958	CH ₂ CH ₂ (2-Pip)	4-OBu	3-OMe
959	CH ₂ CH ₂ (2-Pip)	4-OOc	3-OMe
960	CH ₂ CH ₂ (2-Pip)	4-O-CH ₂ CH=CH ₂	3-OMe
961	CH ₂ CH ₂ (2-Pip)	4-O-CH ₂ C≡CH	3-OMe
962	CH ₂ CH ₂ (2-Pip)	4-Ph	3-OMe
963	CH ₂ CH ₂ (2-Pip)	5-Ph	3-OMe
964	CH ₂ CH ₂ (2-Pip)	6-Ph	3-OMe
965	CH ₂ CH ₂ (2-Pip)	4-OPh	3-OMe
966	CH ₂ CH ₂ (2-Pip)	5-OPh	3-OMe
967	CH ₂ CH ₂ (2-Pip)	6-OPh	3-OMe
968	CH ₂ CH ₂ (2-Pip)	3, 4-(CH=CH-CH=CH)-	3-OMe
969	CH ₂ CH ₂ (2-Pip)	4, 5-(CH=CH-CH=CH)-	3-OMe
970	CH ₂ CH ₂ (2-Pip)	5, 6-(CH=CH-CH=CH)-	3-OMe
971	CH ₂ CH ₂ (1-Me-2-Pip)	4-OH	3-OMe
972	CH ₂ CH ₂ (1-Me-2-Pip)	4-OBu	3-OMe
973	CH ₂ CH ₂ (1-Me-2-Pip)	4-OOc	3-OMe
974	CH ₂ CH ₂ (1-Me-2-Pip)	4-O-CH ₂ CH=CH ₂	3-OMe
975	CH ₂ CH ₂ (1-Me-2-Pip)	4-O-CH ₂ C≡CH	3-OMe
976	CH ₂ CH ₂ (1-Me-2-Pip)	4-Ph	3-OMe
977	CH ₂ CH ₂ (1-Me-2-Pip)	5-Ph	3-OMe
978	CH ₂ CH ₂ (1-Me-2-Pip)	6-Ph	3-OMe
979	CH ₂ CH ₂ (1-Me-2-Pip)	4-OPh	3-OMe
980	CH ₂ CH ₂ (1-Me-2-Pip)	5-OPh	3-OMe
981	CH ₂ CH ₂ (1-Me-2-Pip)	6-OPh	3-OMe
982	CH ₂ CH ₂ (1-Me-2-Pip)	3, 4-(CH=CH-CH=CH)-	3-OMe
983	CH ₂ CH ₂ (1-Me-2-Pip)	4, 5-(CH=CH-CH=CH)-	3-OMe

984	CH ₂ CH ₂ (1-Me-2-Pip)	5, 6-(CH=CH-CH=CH)-	3-OMe
985	CH ₂ (3-Pip)	4-OH	3-OMe
986	CH ₂ (3-Pip)	4-OBu	3-OMe
987	CH ₂ (3-Pip)	4-OOc	3-OMe
988	CH ₂ (3-Pip)	4-O-CH ₂ CH=CH ₂	3-OMe
989	CH ₂ (3-Pip)	4-O-CH ₂ C≡CH	3-OMe
990	CH ₂ (3-Pip)	4-Ph	3-OMe
991	CH ₂ (3-Pip)	5-Ph	3-OMe
992	CH ₂ (3-Pip)	6-Ph	3-OMe
993	CH ₂ (3-Pip)	4-OPh	3-OMe
994	CH ₂ (3-Pip)	5-OPh	3-OMe
995	CH ₂ (3-Pip)	6-OPh	3-OMe
996	CH ₂ (3-Pip)	3, 4-(CH=CH-CH=CH)-	3-OMe
997	CH ₂ (3-Pip)	4, 5-(CH=CH-CH=CH)-	3-OMe
998	CH ₂ (3-Pip)	5, 6-(CH=CH-CH=CH)-	3-OMe
999	CH ₂ (1-Me-3-Pip)	4-OH	3-OMe
1000	CH ₂ (1-Me-3-Pip)	4-OBu	3-OMe
1001	CH ₂ (1-Me-3-Pip)	4-OOc	3-OMe
1002	CH ₂ (1-Me-3-Pip)	4-O-CH ₂ CH=CH ₂	3-OMe
1003	CH ₂ (1-Me-3-Pip)	4-O-CH ₂ C≡CH	3-OMe
1004	CH ₂ (1-Me-3-Pip)	4-Ph	3-OMe
1005	CH ₂ (1-Me-3-Pip)	5-Ph	3-OMe
1006	CH ₂ (1-Me-3-Pip)	6-Ph	3-OMe
1007	CH ₂ (1-Me-3-Pip)	4-OPh	3-OMe
1008	CH ₂ (1-Me-3-Pip)	5-OPh	3-OMe
1009	CH ₂ (1-Me-3-Pip)	6-OPh	3-OMe
1010	CH ₂ (1-Me-3-Pip)	3, 4-(CH=CH-CH=CH)-	3-OMe
1011	CH ₂ (1-Me-3-Pip)	4, 5-(CH=CH-CH=CH)-	3-OMe
1012	CH ₂ (1-Me-3-Pip)	5, 6-(CH=CH-CH=CH)-	3-OMe
1013	CH ₂ CH ₂ NH ₂	4-OBu	4-F
1014	CH ₂ CH ₂ NH ₂	4-O-CH ₂ C≡CH	4-F
1015	CH ₂ CH ₂ NH ₂	4-Ph	4-F
1016	CH ₂ CH ₂ NH ₂	6-Ph	4-F
1017	CH ₂ CH ₂ NH ₂	4-OPh	4-F
1018	CH ₂ CH ₂ NH ₂	6-OPh	4-F
1019	CH ₂ CH ₂ NH ₂	3, 4-(CH=CH-CH=CH)-	4-F
1020	CH ₂ CH ₂ NH ₂	4, 5-(CH=CH-CH=CH)-	4-F
1021	CH ₂ CH ₂ NH ₂	5, 6-(CH=CH-CH=CH)-	4-F
1022	CH ₂ CH ₂ NHMe	4-OBu	4-F
1023	CH ₂ CH ₂ NHMe	4-O-CH ₂ C≡CH	4-F
1024	CH ₂ CH ₂ NHMe	4-Ph	4-F
1025	CH ₂ CH ₂ NHMe	6-Ph	4-F
1026	CH ₂ CH ₂ NHMe	4-OPh	4-F
1027	CH ₂ CH ₂ NHMe	6-OPh	4-F
1028	CH ₂ CH ₂ NHMe	3, 4-(CH=CH-CH=CH)-	4-F
1029	CH ₂ CH ₂ NHMe	4, 5-(CH=CH-CH=CH)-	4-F
1030	CH ₂ CH ₂ NHMe	5, 6-(CH=CH-CH=CH)-	4-F
1031	CH ₂ CH ₂ NMe ₂	4-OBu	4-F
1032	CH ₂ CH ₂ NMe ₂	4-O-CH ₂ C≡CH	4-F
1033	CH ₂ CH ₂ NMe ₂	4-Ph	4-F

1034	CH ₂ CH ₂ NMe ₂	6-Ph	4-F
1035	CH ₂ CH ₂ NMe ₂	4-OPh	4-F
1036	CH ₂ CH ₂ NMe ₂	6-OPh	4-F
1037	CH ₂ CH ₂ NMe ₂	3, 4- (CH=CH-CH=CH) -	4-F
1038	CH ₂ CH ₂ NMe ₂	4, 5- (CH=CH-CH=CH) -	4-F
1039	CH ₂ CH ₂ NMe ₂	5, 6- (CH=CH-CH=CH) -	4-F
1040	CH ₂ CH ₂ (2-Pyr)	4-OBu	4-F
1041	CH ₂ CH ₂ (2-Pyr)	4-O-CH ₂ C≡CH	4-F
1042	CH ₂ CH ₂ (2-Pyr)	4-Ph	4-F
1043	CH ₂ CH ₂ (2-Pyr)	6-Ph	4-F
1044	CH ₂ CH ₂ (2-Pyr)	4-OPh	4-F
1045	CH ₂ CH ₂ (2-Pyr)	6-OPh	4-F
1046	CH ₂ CH ₂ (2-Pyr)	3, 4- (CH=CH-CH=CH) -	4-F
1047	CH ₂ CH ₂ (2-Pyr)	4, 5- (CH=CH-CH=CH) -	4-F
1048	CH ₂ CH ₂ (2-Pyr)	5, 6- (CH=CH-CH=CH) -	4-F
1049	CH ₂ CH ₂ (1-Me-2-Pyr)	4-OBu	4-F
1050	CH ₂ CH ₂ (1-Me-2-Pyr)	4-O-CH ₂ C≡CH	4-F
1051	CH ₂ CH ₂ (1-Me-2-Pyr)	4-Ph	4-F
1052	CH ₂ CH ₂ (1-Me-2-Pyr)	6-Ph	4-F
1053	CH ₂ CH ₂ (1-Me-2-Pyr)	4-OPh	4-F
1054	CH ₂ CH ₂ (1-Me-2-Pyr)	6-OPh	4-F
1055	CH ₂ CH ₂ (1-Me-2-Pyr)	3, 4- (CH=CH-CH=CH) -	4-F
1056	CH ₂ CH ₂ (1-Me-2-Pyr)	4, 5- (CH=CH-CH=CH) -	4-F
1057	CH ₂ CH ₂ (1-Me-2-Pyr)	5, 6- (CH=CH-CH=CH) -	4-F
1058	CH ₂ CH ₂ (4-OH-1-Me-2-Pyr)	4-OBu	4-F
1059	CH ₂ CH ₂ (4-OH-1-Me-2-Pyr)	4-O-CH ₂ C≡CH	4-F
1060	CH ₂ CH ₂ (4-OH-1-Me-2-Pyr)	4-Ph	4-F
1061	CH ₂ CH ₂ (4-OH-1-Me-2-Pyr)	6-Ph	4-F
1062	CH ₂ CH ₂ (4-OH-1-Me-2-Pyr)	4-OPh	4-F
1063	CH ₂ CH ₂ (4-OH-1-Me-2-Pyr)	6-OPh	4-F
1064	CH ₂ CH ₂ (4-OH-1-Me-2-Pyr)	3, 4- (CH=CH-CH=CH) -	4-F
1065	CH ₂ CH ₂ (4-OH-1-Me-2-Pyr)	4, 5- (CH=CH-CH=CH) -	4-F
1066	CH ₂ CH ₂ (4-OH-1-Me-2-Pyr)	5, 6- (CH=CH-CH=CH) -	4-F
1067	CH ₂ CH ₂ (4-OCOOc-1-Me-2-Pyr)	4-OBu	4-F
1068	CH ₂ CH ₂ (4-OCOOc-1-Me-2-Pyr)	4-O-CH ₂ C≡CH	4-F
1069	CH ₂ CH ₂ (4-OCOOc-1-Me-2-Pyr)	4-Ph	4-F
1070	CH ₂ CH ₂ (4-OCOOc-1-Me-2-Pyr)	6-Ph	4-F
1071	CH ₂ CH ₂ (4-OCOOc-1-Me-2-Pyr)	4-OPh	4-F
1072	CH ₂ CH ₂ (4-OCOOc-1-Me-2-Pyr)	6-OPh	4-F
1073	CH ₂ CH ₂ (4-OCOOc-1-Me-2-Pyr)	3, 4- (CH=CH-CH=CH) -	4-F
1074	CH ₂ CH ₂ (4-OCOOc-1-Me-2-Pyr)	4, 5- (CH=CH-CH=CH) -	4-F
1075	CH ₂ CH ₂ (4-OCOOc-1-Me-2-Pyr)	5, 6- (CH=CH-CH=CH) -	4-F
1076	CH ₂ CH ₂ (4-ODec-1-Me-2-Pyr)	4-OBu	4-F
1077	CH ₂ CH ₂ (4-ODec-1-Me-2-Pyr)	4-O-CH ₂ C≡CH	4-F
1078	CH ₂ CH ₂ (4-ODec-1-Me-2-Pyr)	4-Ph	4-F
1079	CH ₂ CH ₂ (4-ODec-1-Me-2-Pyr)	6-Ph	4-F
1080	CH ₂ CH ₂ (4-ODec-1-Me-2-Pyr)	4-OPh	4-F
1081	CH ₂ CH ₂ (4-ODec-1-Me-2-Pyr)	6-OPh	4-F
1082	CH ₂ CH ₂ (4-ODec-1-Me-2-Pyr)	3, 4- (CH=CH-CH=CH) -	4-F
1083	CH ₂ CH ₂ (4-ODec-1-Me-2-Pyr)	4, 5- (CH=CH-CH=CH) -	4-F

1084	CH ₂ CH ₂ (4-ODec-1-Me-2-Pyr)	5, 6-(CH=CH-CH=CH)-	4-F
1085	CH ₂ CH ₂ (4-OLau-1-Me-2-Pyr)	4-OBu	4-F
1086	CH ₂ CH ₂ (4-OLau-1-Me-2-Pyr)	4-O-CH ₂ C≡CH	4-F
1087	CH ₂ CH ₂ (4-OLau-1-Me-2-Pyr)	4-Ph	4-F
1088	CH ₂ CH ₂ (4-OLau-1-Me-2-Pyr)	6-Ph	4-F
1089	CH ₂ CH ₂ (4-OLau-1-Me-2-Pyr)	4-OPh	4-F
1090	CH ₂ CH ₂ (4-OLau-1-Me-2-Pyr)	6-OPh	4-F
1091	CH ₂ CH ₂ (4-OLau-1-Me-2-Pyr)	3, 4-(CH=CH-CH=CH)-	4-F
1092	CH ₂ CH ₂ (4-OLau-1-Me-2-Pyr)	4, 5-(CH=CH-CH=CH)-	4-F
1093	CH ₂ CH ₂ (4-OLau-1-Me-2-Pyr)	5, 6-(CH=CH-CH=CH)-	4-F
1094	CH ₂ CH ₂ NH ₂	4-OBu	3-OMe, 4-F
1095	CH ₂ CH ₂ NH ₂	4-O-CH ₂ C≡CH	3-OMe, 4-F
1096	CH ₂ CH ₂ NH ₂	4-Ph	3-OMe, 4-F
1097	CH ₂ CH ₂ NH ₂	6-Ph	3-OMe, 4-F
1098	CH ₂ CH ₂ NH ₂	4-OPh	3-OMe, 4-F
1099	CH ₂ CH ₂ NH ₂	5-OPh	3-OMe, 4-F
1100	CH ₂ CH ₂ NH ₂	6-OPh	3-OMe, 4-F
1101	CH ₂ CH ₂ NH ₂	3, 4-(CH=CH-CH=CH)-	3-OMe, 4-F
1102	CH ₂ CH ₂ NH ₂	4, 5-(CH=CH-CH=CH)-	3-OMe, 4-F
1103	CH ₂ CH ₂ NH ₂	5, 6-(CH=CH-CH=CH)-	3-OMe, 4-F
1104	CH ₂ CH ₂ NHMe	4-OBu	3-OMe, 4-F
1105	CH ₂ CH ₂ NHMe	4-O-CH ₂ C≡CH	3-OMe, 4-F
1106	CH ₂ CH ₂ NHMe	4-Ph	3-OMe, 4-F
1107	CH ₂ CH ₂ NHMe	6-Ph	3-OMe, 4-F
1108	CH ₂ CH ₂ NHMe	4-OPh	3-OMe, 4-F
1109	CH ₂ CH ₂ NHMe	6-OPh	3-OMe, 4-F
1110	CH ₂ CH ₂ NHMe	3, 4-(CH=CH-CH=CH)-	3-OMe, 4-F
1111	CH ₂ CH ₂ NHMe	4, 5-(CH=CH-CH=CH)-	3-OMe, 4-F
1112	CH ₂ CH ₂ NHMe	5, 6-(CH=CH-CH=CH)-	3-OMe, 4-F
1113	CH ₂ CH ₂ NMe ₂	4-OBu	3-OMe, 4-F
1114	CH ₂ CH ₂ NMe ₂	4-O-CH ₂ C≡CH	3-OMe, 4-F
1115	CH ₂ CH ₂ NMe ₂	4-Ph	3-OMe, 4-F
1116	CH ₂ CH ₂ NMe ₂	6-Ph	3-OMe, 4-F
1117	CH ₂ CH ₂ NMe ₂	4-OPh	3-OMe, 4-F
1118	CH ₂ CH ₂ NMe ₂	6-OPh	3-OMe, 4-F
1119	CH ₂ CH ₂ NMe ₂	3, 4-(CH=CH-CH=CH)-	3-OMe, 4-F
1120	CH ₂ CH ₂ NMe ₂	4, 5-(CH=CH-CH=CH)-	3-OMe, 4-F
1121	CH ₂ CH ₂ NMe ₂	5, 6-(CH=CH-CH=CH)-	3-OMe, 4-F
1122	CH ₂ CH ₂ (2-Pyr)	4-OBu	3-OMe, 4-F
1123	CH ₂ CH ₂ (2-Pyr)	4-O-CH ₂ C≡CH	3-OMe, 4-F
1124	CH ₂ CH ₂ (2-Pyr)	4-Ph	3-OMe, 4-F
1126	CH ₂ CH ₂ (2-Pyr)	4-OPh	3-OMe, 4-F
1127	CH ₂ CH ₂ (2-Pyr)	6-OPh	3-OMe, 4-F
1128	CH ₂ CH ₂ (2-Pyr)	3, 4-(CH=CH-CH=CH)-	3-OMe, 4-F
1129	CH ₂ CH ₂ (2-Pyr)	4, 5-(CH=CH-CH=CH)-	3-OMe, 4-F
1130	CH ₂ CH ₂ (2-Pyr)	5, 6-(CH=CH-CH=CH)-	3-OMe, 4-F
1131	CH ₂ CH ₂ (1-Me-2-Pyr)	4-OBu	3-OMe, 4-F
1132	CH ₂ CH ₂ (1-Me-2-Pyr)	4-O-CH ₂ C≡CH	3-OMe, 4-F
1133	CH ₂ CH ₂ (1-Me-2-Pyr)	4-Ph	3-OMe, 4-F
1134	CH ₂ CH ₂ (1-Me-2-Pyr)	6-Ph	3-OMe, 4-F

1135	CH ₂ CH ₂ (1-Me-2-Pyr)	4-OPh	3-OMe, 4-F
1136	CH ₂ CH ₂ (1-Me-2-Pyr)	6-OPh	3-OMe, 4-F
1137	CH ₂ CH ₂ (1-Me-2-Pyr)	3, 4- (CH=CH-CH=CH) -	3-OMe, 4-F
1138	CH ₂ CH ₂ (1-Me-2-Pyr)	4, 5- (CH=CH-CH=CH) -	3-OMe, 4-F
1139	CH ₂ CH ₂ (1-Me-2-Pyr)	5, 6- (CH=CH-CH=CH) -	3-OMe, 4-F
1140	CH ₂ CH ₂ (4-OH-1-Me-2-Pyr)	4-OBu	3-OMe, 4-F
1141	CH ₂ CH ₂ (4-OH-1-Me-2-Pyr)	4-O-CH ₂ C≡CH	3-OMe, 4-F
1142	CH ₂ CH ₂ (4-OH-1-Me-2-Pyr)	4-Ph	3-OMe, 4-F
1143	CH ₂ CH ₂ (4-OH-1-Me-2-Pyr)	6-Ph	3-OMe, 4-F
1144	CH ₂ CH ₂ (4-OH-1-Me-2-Pyr)	4-OPh	3-OMe, 4-F
1145	CH ₂ CH ₂ (4-OH-1-Me-2-Pyr)	6-OPh	3-OMe, 4-F
1146	CH ₂ CH ₂ (4-OH-1-Me-2-Pyr)	3, 4- (CH=CH-CH=CH) -	3-OMe, 4-F
1147	CH ₂ CH ₂ (4-OH-1-Me-2-Pyr)	4, 5- (CH=CH-CH=CH) -	3-OMe, 4-F
1148	CH ₂ CH ₂ (4-OH-1-Me-2-Pyr)	5, 6- (CH=CH-CH=CH) -	3-OMe, 4-F
1149	CH ₂ CH ₂ (4-OCOOc-1-Me-2-Pyr)	4-OBu	3-OMe, 4-F
1150	CH ₂ CH ₂ (4-OCOOc-1-Me-2-Pyr)	4-O-CH ₂ C≡CH	3-OMe, 4-F
1151	CH ₂ CH ₂ (4-OCOOc-1-Me-2-Pyr)	4-Ph	3-OMe, 4-F
1152	CH ₂ CH ₂ (4-OCOOc-1-Me-2-Pyr)	6-Ph	3-OMe, 4-F
1153	CH ₂ CH ₂ (4-OCOOc-1-Me-2-Pyr)	4-OPh	3-OMe, 4-F
1154	CH ₂ CH ₂ (4-OCOOc-1-Me-2-Pyr)	6-OPh	3-OMe, 4-F
1155	CH ₂ CH ₂ (4-OCOOc-1-Me-2-Pyr)	3, 4- (CH=CH-CH=CH) -	3-OMe, 4-F
1156	CH ₂ CH ₂ (4-OCOOc-1-Me-2-Pyr)	4, 5- (CH=CH-CH=CH) -	3-OMe, 4-F
1157	CH ₂ CH ₂ (4-OCOOc-1-Me-2-Pyr)	5, 6- (CH=CH-CH=CH) -	3-OMe, 4-F
1158	CH ₂ CH ₂ (4-ODec-1-Me-2-Pyr)	4-OBu	3-OMe, 4-F
1159	CH ₂ CH ₂ (4-ODec-1-Me-2-Pyr)	4-O-CH ₂ C≡CH	3-OMe, 4-F
1160	CH ₂ CH ₂ (4-ODec-1-Me-2-Pyr)	4-Ph	3-OMe, 4-F
1161	CH ₂ CH ₂ (4-ODec-1-Me-2-Pyr)	6-Ph	3-OMe, 4-F
1162	CH ₂ CH ₂ (4-ODec-1-Me-2-Pyr)	4-OPh	3-OMe, 4-F
1163	CH ₂ CH ₂ (4-ODec-1-Me-2-Pyr)	6-OPh	3-OMe, 4-F
1164	CH ₂ CH ₂ (4-ODec-1-Me-2-Pyr)	3, 4- (CH=CH-CH=CH) -	3-OMe, 4-F
1165	CH ₂ CH ₂ (4-ODec-1-Me-2-Pyr)	4, 5- (CH=CH-CH=CH) -	3-OMe, 4-F
1166	CH ₂ CH ₂ (4-ODec-1-Me-2-Pyr)	5, 6- (CH=CH-CH=CH) -	3-OMe, 4-F
1167	CH ₂ CH ₂ (4-OLau-1-Me-2-Pyr)	4-O-Bu	3-OMe, 4-F
1168	CH ₂ CH ₂ (4-OLau-1-Me-2-Pyr)	4-O-CH ₂ C≡CH	3-OMe, 4-F
1169	CH ₂ CH ₂ (4-OLau-1-Me-2-Pyr)	4-Ph	3-OMe, 4-F
1170	CH ₂ CH ₂ (4-OLau-1-Me-2-Pyr)	6-Ph	3-OMe, 4-F
1171	CH ₂ CH ₂ (4-OLau-1-Me-2-Pyr)	4-OPh	3-OMe, 4-F
1172	CH ₂ CH ₂ (4-OLau-1-Me-2-Pyr)	6-OPh	3-OMe, 4-F
1173	CH ₂ CH ₂ (4-OLau-1-Me-2-Pyr)	3, 4- (CH=CH-CH=CH) -	3-OMe, 4-F
1174	CH ₂ CH ₂ (4-OLau-1-Me-2-Pyr)	4, 5- (CH=CH-CH=CH) -	3-OMe, 4-F
1175	CH ₂ CH ₂ (4-OLau-1-Me-2-Pyr)	5, 6- (CH=CH-CH=CH) -	3-OMe, 4-F
1176	CH ₂ CH ₂ NH ₂	4-OBu	2-F
1177	CH ₂ CH ₂ NH ₂	4-Ph	2-F
1178	CH ₂ CH ₂ NH ₂	6-Ph	2-F
1179	CH ₂ CH ₂ NH ₂	4-OPh	2-F
1180	CH ₂ CH ₂ NMe ₂	4-OBu	2-F
1181	CH ₂ CH ₂ NMe ₂	4-Ph	2-F
1182	CH ₂ CH ₂ NMe ₂	6-Ph	2-F
1183	CH ₂ CH ₂ NMe ₂	4-OPh	2-F
1184	CH ₂ CH ₂ NMe ₂	3, 4- (CH=CH-CH=CH) -	2-F

1185	CH ₂ CH ₂ NMe ₂	4, 5-(CH=CH-CH=CH)-	2-F
1186	CH ₂ CH ₂ NMe ₂	5, 6-(CH=CH-CH=CH)-	2-F
1187	CH ₂ CH ₂ (2-Pyr)	4-OBu	2-F
1188	CH ₂ CH ₂ (2-Pyr)	4-Ph	2-F
1189	CH ₂ CH ₂ (2-Pyr)	6-Ph	2-F
1190	CH ₂ CH ₂ (2-Pyr)	4-OPh	2-F
1191	CH ₂ CH ₂ (2-Pyr)	4, 5-(CH=CH-CH=CH)-	2-F
1192	CH ₂ CH ₂ (1-Me-2-Pyr)	4-OBu	2-F
1193	CH ₂ CH ₂ (1-Me-2-Pyr)	4-Ph	2-F
1194	CH ₂ CH ₂ (1-Me-2-Pyr)	6-Ph	2-F
1195	CH ₂ CH ₂ (1-Me-2-Pyr)	4-OPh	2-F
1196	CH ₂ CH ₂ (1-Me-2-Pyr)	3, 4-(CH=CH-CH=CH)-	2-F
1197	CH ₂ CH ₂ (1-Me-2-Pyr)	4, 5-(CH=CH-CH=CH)-	2-F
1198	CH ₂ CH ₂ (4-OH-1-Me-2-Pyr)	4-OBu	2-F
1199	CH ₂ CH ₂ (4-OH-1-Me-2-Pyr)	4-O-CH ₂ C≡CH	2-F
1200	CH ₂ CH ₂ (4-OH-1-Me-2-Pyr)	4-Ph	2-F
1201	CH ₂ CH ₂ (4-OH-1-Me-2-Pyr)	6-Ph	2-F
1202	CH ₂ CH ₂ (4-OH-1-Me-2-Pyr)	4-OPh	2-F
1203	CH ₂ CH ₂ (4-OH-1-Me-2-Pyr)	6-OPh	2-F
1204	CH ₂ CH ₂ (4-OH-1-Me-2-Pyr)	4, 5-(CH=CH-CH=CH)-	2-F
1205	CH ₂ CH ₂ (4-OCOOc-1-Me-2-Pyr)	4-OBu	2-F
1206	CH ₂ CH ₂ (4-OCOOc-1-Me-2-Pyr)	4-Ph	2-F
1207	CH ₂ CH ₂ (4-OCOOc-1-Me-2-Pyr)	6-Ph	2-F
1208	CH ₂ CH ₂ (4-OCOOc-1-Me-2-Pyr)	4-OPh	2-F
1209	CH ₂ CH ₂ (4-OCOOc-1-Me-2-Pyr)	4, 5-(CH=CH-CH=CH)-	2-F
1210	CH ₂ CH ₂ (4-ODec-1-Me-2-Pyr)	4-Ph	2-F
1211	CH ₂ CH ₂ (4-ODec-1-Me-2-Pyr)	6-Ph	2-F
1212	CH ₂ CH ₂ (4-ODec-1-Me-2-Pyr)	4-OPh	2-F
1 2 1 3	CH ₂ CH ₂ (4-ODec-1-Me-2-Pyr)	6-OPh	2-F
1214	CH ₂ CH ₂ (4-ODec-1-Me-2-Pyr)	4, 5-(CH=CH-CH=CH)-	2-F
1215	CH ₂ CH ₂ (4-OLau-1-Me-2-Pyr)	4-OBu	2-F
1216	CH ₂ CH ₂ (4-OLau-1-Me-2-Pyr)	4-O-CH ₂ C≡CH	2-F
1217	CH ₂ CH ₂ (4-OLau-1-Me-2-Pyr)	4-Ph	2-F
1218	CH ₂ CH ₂ (4-OLau-1-Me-2-Pyr)	6-Ph	2-F
1219	CH ₂ CH ₂ (4-OLau-1-Me-2-Pyr)	4-OPh	2-F
1220	CH ₂ CH ₂ (4-OLau-1-Me-2-Pyr)	6-OPh	2-F
1221	CH ₂ CH ₂ (4-OLau-1-Me-2-Pyr)	3, 4-(CH=CH-CH=CH)-	2-F
1222	CH ₂ CH ₂ (4-OLau-1-Me-2-Pyr)	4, 5-(CH=CH-CH=CH)-	2-F
1223	CH ₂ CH ₂ (4-OLau-1-Me-2-Pyr)	5, 6-(CH=CH-CH=CH)-	2-F
1224	CH ₂ CH ₂ NH ₂	4-OBu	3-F
1225	CH ₂ CH ₂ NH ₂	4-Ph	3-F
1226	CH ₂ CH ₂ NH ₂	6-Ph	3-F
1227	CH ₂ CH ₂ NH ₂	4-OPh	3-F
1228	CH ₂ CH ₂ NH ₂	4, 5-(CH=CH-CH=CH)-	3-F
1229	CH ₂ CH ₂ NMe ₂	4-OBu	3-F
1230	CH ₂ CH ₂ NMe ₂	4-Ph	3-F
1231	CH ₂ CH ₂ NMe ₂	6-Ph	3-F
1232	CH ₂ CH ₂ NMe ₂	4-OPh	3-F
1233	CH ₂ CH ₂ NMe ₂	3, 4-(CH=CH-CH=CH)-	3-F
1234	CH ₂ CH ₂ NMe ₂	4, 5-(CH=CH-CH=CH)-	3-F

1235	CH ₂ CH ₂ (2-Pyr)	4-OBu	3-F
1236	CH ₂ CH ₂ (2-Pyr)	4-Ph	3-F
1237	CH ₂ CH ₂ (2-Pyr)	6-Ph	3-F
1238	CH ₂ CH ₂ (2-Pyr)	4-OPh	3-F
1239	CH ₂ CH ₂ (2-Pyr)	4, 5- (CH=CH-CH=CH) -	3-F
1240	CH ₂ CH ₂ (1-Me-2-Pyr)	4-OBu	3-F
1241	CH ₂ CH ₂ (1-Me-2-Pyr)	4-Ph	3-F
1242	CH ₂ CH ₂ (1-Me-2-Pyr)	6-Ph	3-F
1243	CH ₂ CH ₂ (1-Me-2-Pyr)	4-OPh	3-F
1244	CH ₂ CH ₂ (1-Me-2-Pyr)	3, 4- (CH=CH-CH=CH) -	3-F
1245	CH ₂ CH ₂ (1-Me-2-Pyr)	4, 5- (CH=CH-CH=CH) -	3-F
1246	CH ₂ CH ₂ (4-OH-1-Me-2-Pyr)	4-OBu	3-F
1247	CH ₂ CH ₂ (4-OH-1-Me-2-Pyr)	4-O-CH ₂ C≡CH	3-F
1248	CH ₂ CH ₂ (4-OH-1-Me-2-Pyr)	4-Ph	3-F
1249	CH ₂ CH ₂ (4-OH-1-Me-2-Pyr)	6-Ph	3-F
1250	CH ₂ CH ₂ (4-OH-1-Me-2-Pyr)	4-OPh	3-F
1251	CH ₂ CH ₂ (4-OH-1-Me-2-Pyr)	6-OPh	3-F
1252	CH ₂ CH ₂ (4-OH-1-Me-2-Pyr)	4, 5- (CH=CH-CH=CH) -	3-F
1253	CH ₂ CH ₂ (4-OCOOc-1-Me-2-Pyr)	4-OBu	3-F
1254	CH ₂ CH ₂ (4-OCOOc-1-Me-2-Pyr)	4-Ph	3-F
1255	CH ₂ CH ₂ (4-OCOOc-1-Me-2-Pyr)	6-Ph	3-F
1256	CH ₂ CH ₂ (4-OCOOc-1-Me-2-Pyr)	4-OPh	3-F
1257	CH ₂ CH ₂ (4-OCOOc-1-Me-2-Pyr)	4, 5- (CH=CH-CH=CH) -	3-F
1258	CH ₂ CH ₂ (4-ODec-1-Me-2-Pyr)	4-OBu	3-F
1259	CH ₂ CH ₂ (4-ODec-1-Me-2-Pyr)	4-Ph	3-F
1260	CH ₂ CH ₂ (4-ODec-1-Me-2-Pyr)	6-Ph	3-F
1261	CH ₂ CH ₂ (4-ODec-1-Me-2-Pyr)	4-OPh	3-F
1262	CH ₂ CH ₂ (4-ODec-1-Me-2-Pyr)	4, 5- (CH=CH-CH=CH) -	3-F
1263	CH ₂ CH ₂ (4-OLau-1-Me-2-Pyr)	4-OBu	3-F
1264	CH ₂ CH ₂ (4-OLau-1-Me-2-Pyr)	4-O-CH ₂ C≡CH	3-F
1265	CH ₂ CH ₂ (4-OLau-1-Me-2-Pyr)	4-Ph	3-F
1266	CH ₂ CH ₂ (4-OLau-1-Me-2-Pyr)	6-Ph	3-F
1267	CH ₂ CH ₂ (4-OLau-1-Me-2-Pyr)	4-OPh	3-F
1268	CH ₂ CH ₂ (4-OLau-1-Me-2-Pyr)	6-OPh	3-F
1269	CH ₂ CH ₂ (4-OLau-1-Me-2-Pyr)	3, 4- (CH=CH-CH=CH) -	3-F
1270	CH ₂ CH ₂ (4-OLau-1-Me-2-Pyr)	4, 5- (CH=CH-CH=CH) -	3-F
1271	CH ₂ CH ₂ (4-OLau-1-Me-2-Pyr)	5, 6- (CH=CH-CH=CH) -	3-F
1272	CH ₂ CH ₂ NH ₂	4-OBu	2-OMe
1273	CH ₂ CH ₂ NH ₂	4-Ph	2-OMe
1274	CH ₂ CH ₂ NH ₂	6-Ph	2-OMe
1275	CH ₂ CH ₂ NH ₂	4-OPh	2-OMe
1276	CH ₂ CH ₂ NH ₂	4, 5- (CH=CH-CH=CH) -	2-OMe
1277	CH ₂ CH ₂ NMe ₂	4-OBu	2-OMe
1278	CH ₂ CH ₂ NMe ₂	4-Ph	2-OMe
1279	CH ₂ CH ₂ NMe ₂	6-Ph	2-OMe
1280	CH ₂ CH ₂ NMe ₂	4-OPh	2-OMe
1281	CH ₂ CH ₂ NMe ₂	3, 4- (CH=CH-CH=CH) -	2-OMe
1282	CH ₂ CH ₂ NMe ₂	4, 5- (CH=CH-CH=CH) -	2-OMe
1283	CH ₂ CH ₂ (2-Pyr)	4-OBu	2-OMe
1284	CH ₂ CH ₂ (2-Pyr)	4-Ph	2-OMe

1285	CH ₂ CH ₂ (2-Pyr)	6-Ph	2-OMe
1286	CH ₂ CH ₂ (2-Pyr)	4-OPh	2-OMe
1287	CH ₂ CH ₂ (2-Pyr)	4, 5- (CH=CH-CH=CH) -	2-OMe
1288	CH ₂ CH ₂ (1-Me-2-Pyr)	4-OBu	2-OMe
1289	CH ₂ CH ₂ (1-Me-2-Pyr)	4-Ph	2-OMe
1290	CH ₂ CH ₂ (1-Me-2-Pyr)	6-Ph	2-OMe
1291	CH ₂ CH ₂ (1-Me-2-Pyr)	4-OPh	2-OMe
1292	CH ₂ CH ₂ (1-Me-2-Pyr)	3, 4- (CH=CH-CH=CH) -	2-OMe
1293	CH ₂ CH ₂ (1-Me-2-Pyr)	4, 5- (CH=CH-CH=CH) -	2-OMe
1294	CH ₂ CH ₂ (4-OH-1-Me-2-Pyr)	4-OBu	2-OMe
1295	CH ₂ CH ₂ (4-OH-1-Me-2-Pyr)	4-O-CH ₂ C≡CH	2-OMe
1296	CH ₂ CH ₂ (4-OH-1-Me-2-Pyr)	4-Ph	2-OMe
1297	CH ₂ CH ₂ (4-OH-1-Me-2-Pyr)	6-Ph	2-OMe
1298	CH ₂ CH ₂ (4-OH-1-Me-2-Pyr)	4-OPh	2-OMe
1299	CH ₂ CH ₂ (4-OH-1-Me-2-Pyr)	6-OPh	2-OMe
1300	CH ₂ CH ₂ (4-OH-1-Me-2-Pyr)	4, 5- (CH=CH-CH=CH) -	2-OMe
1301	CH ₂ CH ₂ (4-OCOOc-1-Me-2-Pyr)	4-OBu	2-OMe
1302	CH ₂ CH ₂ (4-OCOOc-1-Me-2-Pyr)	4-Ph	2-OMe
1303	CH ₂ CH ₂ (4-OCOOc-1-Me-2-Pyr)	6-Ph	2-OMe
1304	CH ₂ CH ₂ (4-OCOOc-1-Me-2-Pyr)	4-OPh	2-OMe
1305	CH ₂ CH ₂ (4-OCOOc-1-Me-2-Pyr)	4, 5- (CH=CH-CH=CH) -	2-OMe
1306	CH ₂ CH ₂ (4-ODec-1-Me-2-Pyr)	4-OBu	2-OMe
1307	CH ₂ CH ₂ (4-ODec-1-Me-2-Pyr)	4-Ph	2-OMe
1308	CH ₂ CH ₂ (4-ODec-1-Me-2-Pyr)	6-Ph	2-OMe
1309	CH ₂ CH ₂ (4-ODec-1-Me-2-Pyr)	4-OPh	2-OMe
1310	CH ₂ CH ₂ (4-ODec-1-Me-2-Pyr)	4, 5- (CH=CH-CH=CH) -	2-OMe
1311	CH ₂ CH ₂ (4-OLau-1-Me-2-Pyr)	4-OBu	2-OMe
1312	CH ₂ CH ₂ (4-OLau-1-Me-2-Pyr)	4-O-CH ₂ C≡CH	2-OMe
1313	CH ₂ CH ₂ (4-OLau-1-Me-2-Pyr)	4-Ph	2-OMe
1314	CH ₂ CH ₂ (4-OLau-1-Me-2-Pyr)	6-Ph	2-OMe
1315	CH ₂ CH ₂ (4-OLau-1-Me-2-Pyr)	4-OPh	2-OMe
1316	CH ₂ CH ₂ (4-OLau-1-Me-2-Pyr)	6-OPh	2-OMe
1317	CH ₂ CH ₂ (4-OLau-1-Me-2-Pyr)	3, 4- (CH=CH-CH=CH) -	2-OMe
1318	CH ₂ CH ₂ (4-OLau-1-Me-2-Pyr)	4, 5- (CH=CH-CH=CH) -	2-OMe
1319	CH ₂ CH ₂ (4-OLau-1-Me-2-Pyr)	5, 6- (CH=CH-CH=CH) -	2-OMe
1320	CH ₂ CH ₂ NH ₂	4-OBu	4-OMe
1321	CH ₂ CH ₂ NH ₂	4-Ph	4-OMe
1322	CH ₂ CH ₂ NH ₂	6-Ph	4-OMe
1323	CH ₂ CH ₂ NH ₂	4-OPh	4-OMe
1324	CH ₂ CH ₂ NH ₂	4, 5- (CH=CH-CH=CH) -	4-OMe
1325	CH ₂ CH ₂ NMe ₂	4-OBu	4-OMe
1326	CH ₂ CH ₂ NMe ₂	4-Ph	4-OMe
1327	CH ₂ CH ₂ NMe ₂	6-Ph	4-OMe
1328	CH ₂ CH ₂ NMe ₂	4-OPh	4-OMe
1329	CH ₂ CH ₂ NMe ₂	3, 4- (CH=CH-CH=CH) -	4-OMe
1330	CH ₂ CH ₂ NMe ₂	4, 5- (CH=CH-CH=CH) -	4-OMe
1331	CH ₂ CH ₂ (2-Pyr)	4-OBu	4-OMe
1332	CH ₂ CH ₂ (2-Pyr)	4-Ph	4-OMe
1333	CH ₂ CH ₂ (2-Pyr)	6-Ph	4-OMe
1334	CH ₂ CH ₂ (2-Pyr)	4-OPh	4-OMe

1335	CH ₂ CH ₂ (2-Pyr)	4, 5- (CH=CH-CH=CH) -	4-OMe
1336	CH ₂ CH ₂ (1-Me-2-Pyr)	4-OBu	4-OMe
1337	CH ₂ CH ₂ (1-Me-2-Pyr)	4-Ph	4-OMe
1338	CH ₂ CH ₂ (1-Me-2-Pyr)	6-Ph	4-OMe
1339	CH ₂ CH ₂ (1-Me-2-Pyr)	4-OPh	4-OMe
1340	CH ₂ CH ₂ (1-Me-2-Pyr)	3, 4- (CH=CH-CH=CH) -	4-OMe
1341	CH ₂ CH ₂ (1-Me-2-Pyr)	4, 5- (CH=CH-CH=CH) -	4-OMe
1342	CH ₂ CH ₂ (4-OH-1-Me-2-Pyr)	4-OBu	4-OMe
1343	CH ₂ CH ₂ (4-OH-1-Me-2-Pyr)	4-O-CH ₂ C≡CH	4-OMe
1344	CH ₂ CH ₂ (4-OH-1-Me-2-Pyr)	4-Ph	4-OMe
1345	CH ₂ CH ₂ (4-OH-1-Me-2-Pyr)	6-Ph	4-OMe
1346	CH ₂ CH ₂ (4-OH-1-Me-2-Pyr)	4-OPh	4-OMe
1347	CH ₂ CH ₂ (4-OH-1-Me-2-Pyr)	6-OPh	4-OMe
1348	CH ₂ CH ₂ (4-OH-1-Me-2-Pyr)	4, 5- (CH=CH-CH=CH) -	4-OMe
1349	CH ₂ CH ₂ (4-OCOOc-1-Me-2-Pyr)	4-OBu	4-OMe
1350	CH ₂ CH ₂ (4-OCOOc-1-Me-2-Pyr)	4-Ph	4-OMe
1351	CH ₂ CH ₂ (4-OCOOc-1-Me-2-Pyr)	6-Ph	4-OMe
1352	CH ₂ CH ₂ (4-OCOOc-1-Me-2-Pyr)	4-OPh	4-OMe
1353	CH ₂ CH ₂ (4-OCOOc-1-Me-2-Pyr)	4, 5- (CH=CH-CH=CH) -	4-OMe
1354	CH ₂ CH ₂ (4-ODec-1-Me-2-Pyr)	4-OBu	4-OMe
1355	CH ₂ CH ₂ (4-ODec-1-Me-2-Pyr)	4-Ph	4-OMe
1356	CH ₂ CH ₂ (4-ODec-1-Me-2-Pyr)	6-Ph	4-OMe
1357	CH ₂ CH ₂ (4-ODec-1-Me-2-Pyr)	4-OPh	4-OMe
1358	CH ₂ CH ₂ (4-ODec-1-Me-2-Pyr)	4, 5- (CH=CH-CH=CH) -	4-OMe
1359	CH ₂ CH ₂ (4-OLau-1-Me-2-Pyr)	4-OBu	4-OMe
1360	CH ₂ CH ₂ (4-OLau-1-Me-2-Pyr)	4-O-CH ₂ C≡CH	4-OMe
1361	CH ₂ CH ₂ (4-OLau-1-Me-2-Pyr)	4-Ph	4-OMe
1362	CH ₂ CH ₂ (4-OLau-1-Me-2-Pyr)	6-Ph	4-OMe
1363	CH ₂ CH ₂ (4-OLau-1-Me-2-Pyr)	4-OPh	4-OMe
1364	CH ₂ CH ₂ (4-OLau-1-Me-2-Pyr)	6-OPh	4-OMe
1365	CH ₂ CH ₂ (4-OLau-1-Me-2-Pyr)	3, 4- (CH=CH-CH=CH) -	4-OMe
1366	CH ₂ CH ₂ (4-OLau-1-Me-2-Pyr)	4, 5- (CH=CH-CH=CH) -	4-OMe
1367	CH ₂ CH ₂ (4-OLau-1-Me-2-Pyr)	5, 6- (CH=CH-CH=CH) -	4-OMe
1368	CH ₂ CH ₂ (2-Pyr)	4-OBu	2-Me
1369	CH ₂ CH ₂ (2-Pyr)	4-Ph	2-Me
1370	CH ₂ CH ₂ (2-Pyr)	6-Ph	2-Me
1371	CH ₂ CH ₂ (2-Pyr)	4-OPh	2-Me
1372	CH ₂ CH ₂ (1-Me-2-Pyr)	4-OBu	2-Me
1373	CH ₂ CH ₂ (1-Me-2-Pyr)	4-Ph	2-Me
1374	CH ₂ CH ₂ (1-Me-2-Pyr)	6-Ph	2-Me
1375	CH ₂ CH ₂ (1-Me-2-Pyr)	4-OPh	2-Me
1376	CH ₂ CH ₂ (4-OH-1-Me-2-Pyr)	4-OBu	2-Me
1377	CH ₂ CH ₂ (4-OH-1-Me-2-Pyr)	4-Ph	2-Me
1378	CH ₂ CH ₂ (4-OH-1-Me-2-Pyr)	6-Ph	2-Me
1379	CH ₂ CH ₂ (4-OH-1-Me-2-Pyr)	4-OPh	2-Me
1380	CH ₂ CH ₂ (4-OLau-1-Me-2-Pyr)	4-OBu	2-Me
1381	CH ₂ CH ₂ (4-OLau-1-Me-2-Pyr)	4-O-CH ₂ C≡CH	2-Me
1382	CH ₂ CH ₂ (4-OLau-1-Me-2-Pyr)	4-Ph	2-Me
1383	CH ₂ CH ₂ (4-OLau-1-Me-2-Pyr)	6-Ph	2-Me
1384	CH ₂ CH ₂ (4-OLau-1-Me-2-Pyr)	4-OPh	2-Me

1385	CH ₂ CH ₂ (4-OLau-1-Me-2-Pyr)	4, 5-(CH=CH-CH=CH)-	2-Me
1386	CH ₂ CH ₂ (2-Pyr)	4-Ph	3-Me
1387	CH ₂ CH ₂ (2-Pyr)	6-Ph	3-Me
1388	CH ₂ CH ₂ (2-Pyr)	4-OPh	3-Me
1389	CH ₂ CH ₂ (1-Me-2-Pyr)	4-Ph	3-Me
1390	CH ₂ CH ₂ (1-Me-2-Pyr)	6-Ph	3-Me
1391	CH ₂ CH ₂ (1-Me-2-Pyr)	4-OPh	3-Me
1392	CH ₂ CH ₂ (1-Me-2-Pyr)	4, 5-(CH=CH-CH=CH)-	3-Me
1393	CH ₂ CH ₂ (4-OH-1-Me-2-Pyr)	4-Ph	3-Me
1394	CH ₂ CH ₂ (4-OH-1-Me-2-Pyr)	6-Ph	3-Me
1395	CH ₂ CH ₂ (4-OH-1-Me-2-Pyr)	4-OPh	3-Me
1396	CH ₂ CH ₂ (4-OH-1-Me-2-Pyr)	4, 5-(CH=CH-CH=CH)-	3-Me
1397	CH ₂ CH ₂ (4-OLau-1-Me-2-Pyr)	4-OBu	3-Me
1398	CH ₂ CH ₂ (4-OLau-1-Me-2-Pyr)	4-O-CH ₂ C≡CH	3-Me
1399	CH ₂ CH ₂ (4-OLau-1-Me-2-Pyr)	4-Ph	3-Me
1400	CH ₂ CH ₂ (4-OLau-1-Me-2-Pyr)	6-Ph	3-Me
1401	CH ₂ CH ₂ (4-OLau-1-Me-2-Pyr)	4-OPh	3-Me
1402	CH ₂ CH ₂ (4-OLau-1-Me-2-Pyr)	4, 5-(CH=CH-CH=CH)-	3-Me
1403	CH ₂ CH ₂ NMe ₂	4-Ph	4-Me
1404	CH ₂ CH ₂ NMe ₂	6-Ph	4-Me
1405	CH ₂ CH ₂ NMe ₂	4-OPh	4-Me
1406	CH ₂ CH ₂ NMe ₂	4, 5-(CH=CH-CH=CH)-	4-Me
1407	CH ₂ CH ₂ (2-Pyr)	4-Ph	4-Me
1408	CH ₂ CH ₂ (2-Pyr)	6-Ph	4-Me
1409	CH ₂ CH ₂ (2-Pyr)	4-OPh	4-Me
1410	CH ₂ CH ₂ (2-Pyr)	4, 5-(CH=CH-CH=CH)-	4-Me
1411	CH ₂ CH ₂ (1-Me-2-Pyr)	4-Ph	4-Me
1412	CH ₂ CH ₂ (1-Me-2-Pyr)	6-Ph	4-Me
1413	CH ₂ CH ₂ (1-Me-2-Pyr)	4-OPh	4-Me
1414	CH ₂ CH ₂ (1-Me-2-Pyr)	4, 5-(CH=CH-CH=CH)-	4-Me
1415	CH ₂ CH ₂ (4-OH-1-Me-2-Pyr)	4-Ph	4-Me
1416	CH ₂ CH ₂ (4-OH-1-Me-2-Pyr)	6-Ph	4-Me
1417	CH ₂ CH ₂ (4-OH-1-Me-2-Pyr)	4-OPh	4-Me
1418	CH ₂ CH ₂ (4-OH-1-Me-2-Pyr)	4, 5-(CH=CH-CH=CH)-	4-Me
1419	CH ₂ CH ₂ (4-OCOOc-1-Me-2-Pyr)	4-Ph	4-Me
1420	CH ₂ CH ₂ (4-OCOOc-1-Me-2-Pyr)	6-Ph	4-Me
1421	CH ₂ CH ₂ (4-OCOOc-1-Me-2-Pyr)	4-OPh	4-Me
1422	CH ₂ CH ₂ (4-OCOOc-1-Me-2-Pyr)	4, 5-(CH=CH-CH=CH)-	4-Me
1423	CH ₂ CH ₂ (4-ODec-1-Me-2-Pyr)	4-Ph	4-Me
1424	CH ₂ CH ₂ (4-ODec-1-Me-2-Pyr)	6-Ph	4-Me
1425	CH ₂ CH ₂ (4-ODec-1-Me-2-Pyr)	4-OPh	4-Me
1426	CH ₂ CH ₂ (4-ODec-1-Me-2-Pyr)	4, 5-(CH=CH-CH=CH)-	4-Me
1427	CH ₂ CH ₂ (4-OLau-1-Me-2-Pyr)	4-OBu	4-Me
1428	CH ₂ CH ₂ (4-OLau-1-Me-2-Pyr)	4-O-CH ₂ C≡CH	4-Me
1429	CH ₂ CH ₂ (4-OLau-1-Me-2-Pyr)	4-Ph	4-Me
1430	CH ₂ CH ₂ (4-OLau-1-Me-2-Pyr)	6-Ph	4-Me
1431	CH ₂ CH ₂ (4-OLau-1-Me-2-Pyr)	4-OPh	4-Me
1432	CH ₂ CH ₂ (4-OLau-1-Me-2-Pyr)	6-OPh	4-Me
1433	CH ₂ CH ₂ (4-OLau-1-Me-2-Pyr)	3, 4-(CH=CH-CH=CH)-	4-Me
1434	CH ₂ CH ₂ (4-OLau-1-Me-2-Pyr)	4, 5-(CH=CH-CH=CH)-	4-Me

1435	CH ₂ CH ₂ (4-OLau-1-Me-2-Pyr)	5, 6- (CH=CH-CH=CH) -	4-Me
1436	CH ₂ CH ₂ (2-Pyr)	4-Ph	2-Cl
1437	CH ₂ CH ₂ (2-Pyr)	6-Ph	2-Cl
1438	CH ₂ CH ₂ (2-Pyr)	4-OPh	2-Cl
1439	CH ₂ CH ₂ (2-Pyr)	4, 5- (CH=CH-CH=CH) -	2-Cl
1440	CH ₂ CH ₂ (1-Me-2-Pyr)	4-Ph	2-Cl
1441	CH ₂ CH ₂ (1-Me-2-Pyr)	6-Ph	2-Cl
1442	CH ₂ CH ₂ (1-Me-2-Pyr)	4-OPh	2-Cl
1443	CH ₂ CH ₂ (1-Me-2-Pyr)	4, 5- (CH=CH-CH=CH) -	2-Cl
1444	CH ₂ CH ₂ (4-OH-1-Me-2-Pyr)	4-Ph	2-Cl
1445	CH ₂ CH ₂ (4-OH-1-Me-2-Pyr)	6-Ph	2-Cl
1446	CH ₂ CH ₂ (4-OH-1-Me-2-Pyr)	4-OPh	2-Cl
1447	CH ₂ CH ₂ (4-OH-1-Me-2-Pyr)	4, 5- (CH=CH-CH=CH) -	2-Cl
1448	CH ₂ CH ₂ (4-OLau-1-Me-2-Pyr)	4-OBu	2-Cl
1449	CH ₂ CH ₂ (4-OLau-1-Me-2-Pyr)	4-O-CH ₂ C≡CH	2-Cl
1450	CH ₂ CH ₂ (4-OLau-1-Me-2-Pyr)	4-Ph	2-Cl
1451	CH ₂ CH ₂ (4-OLau-1-Me-2-Pyr)	6-Ph	2-Cl
1452	CH ₂ CH ₂ (4-OLau-1-Me-2-Pyr)	4-OPh	2-Cl
1453	CH ₂ CH ₂ (4-OLau-1-Me-2-Pyr)	4, 5- (CH=CH-CH=CH) -	2-Cl
1454	CH ₂ CH ₂ (2-Pyr)	6-Ph	3-Cl
1455	CH ₂ CH ₂ (2-Pyr)	4-OPh	3-Cl
1456	CH ₂ CH ₂ (2-Pyr)	4, 5- (CH=CH-CH=CH) -	3-Cl
1457	CH ₂ CH ₂ (1-Me-2-Pyr)	4-Ph	3-Cl
1458	CH ₂ CH ₂ (1-Me-2-Pyr)	6-Ph	3-Cl
1459	CH ₂ CH ₂ (1-Me-2-Pyr)	4-OPh	3-Cl
1460	CH ₂ CH ₂ (1-Me-2-Pyr)	4, 5- (CH=CH-CH=CH) -	3-Cl
1461	CH ₂ CH ₂ (4-OH-1-Me-2-Pyr)	4-Ph	3-Cl
1462	CH ₂ CH ₂ (4-OH-1-Me-2-Pyr)	6-Ph	3-Cl
1463	CH ₂ CH ₂ (4-OH-1-Me-2-Pyr)	4-OPh	3-Cl
1464	CH ₂ CH ₂ (4-OH-1-Me-2-Pyr)	4, 5- (CH=CH-CH=CH) -	3-Cl
1465	CH ₂ CH ₂ (4-OLau-1-Me-2-Pyr)	4-OBu	3-Cl
1466	CH ₂ CH ₂ (4-OLau-1-Me-2-Pyr)	4-O-CH ₂ C≡CH	3-Cl
1467	CH ₂ CH ₂ (4-OLau-1-Me-2-Pyr)	4-Ph	3-Cl
1468	CH ₂ CH ₂ (4-OLau-1-Me-2-Pyr)	6-Ph	3-Cl
1469	CH ₂ CH ₂ (4-OLau-1-Me-2-Pyr)	4-OPh	3-Cl
1470	CH ₂ CH ₂ (4-OLau-1-Me-2-Pyr)	4, 5- (CH=CH-CH=CH) -	3-Cl
1471	CH ₂ CH ₂ NMe ₂	4-Ph	4-Cl
1472	CH ₂ CH ₂ NMe ₂	6-Ph	4-Cl
1473	CH ₂ CH ₂ NMe ₂	4-OPh	4-Cl
1474	CH ₂ CH ₂ NMe ₂	4, 5- (CH=CH-CH=CH) -	4-Cl
1475	CH ₂ CH ₂ (2-Pyr)	4-Ph	4-Cl
1476	CH ₂ CH ₂ (2-Pyr)	6-Ph	4-Cl
1477	CH ₂ CH ₂ (2-Pyr)	4-OPh	4-Cl
1478	CH ₂ CH ₂ (2-Pyr)	4, 5- (CH=CH-CH=CH) -	4-Cl
1479	CH ₂ CH ₂ (1-Me-2-Pyr)	4-Ph	4-Cl
1480	CH ₂ CH ₂ (1-Me-2-Pyr)	6-Ph	4-Cl
1481	CH ₂ CH ₂ (1-Me-2-Pyr)	4-OPh	4-Cl
1482	CH ₂ CH ₂ (1-Me-2-Pyr)	4, 5- (CH=CH-CH=CH) -	4-Cl
1483	CH ₂ CH ₂ (4-OH-1-Me-2-Pyr)	4-Ph	4-Cl
1484	CH ₂ CH ₂ (4-OH-1-Me-2-Pyr)	6-Ph	4-Cl

1485	CH ₂ CH ₂ (4-OH-1-Me-2-Pyr)	4-OPh	4-Cl
1486	CH ₂ CH ₂ (4-OH-1-Me-2-Pyr)	4, 5- (CH=CH-CH=CH) -	4-Cl
1487	CH ₂ CH ₂ (4-OCOOc-1-Me-2-Pyr)	4-Ph	4-Cl
1488	CH ₂ CH ₂ (4-OCOOc-1-Me-2-Pyr)	6-Ph	4-Cl
1489	CH ₂ CH ₂ (4-OCOOc-1-Me-2-Pyr)	4-OPh	4-Cl
1490	CH ₂ CH ₂ (4-OCOOc-1-Me-2-Pyr)	4, 5- (CH=CH-CH=CH) -	4-Cl
1491	CH ₂ CH ₂ (4-ODec-1-Me-2-Pyr)	4-Ph	4-Cl
1492	CH ₂ CH ₂ (4-ODec-1-Me-2-Pyr)	6-Ph	4-Cl
1493	CH ₂ CH ₂ (4-ODec-1-Me-2-Pyr)	4-OPh	4-Cl
1494	CH ₂ CH ₂ (4-ODec-1-Me-2-Pyr)	4, 5- (CH=CH-CH=CH) -	4-Cl
1495	CH ₂ CH ₂ (4-OLau-1-Me-2-Pyr)	4-OBu	4-Cl
1496	CH ₂ CH ₂ (4-OLau-1-Me-2-Pyr)	4-O-CH ₂ C≡CH	4-Cl
1497	CH ₂ CH ₂ (4-OLau-1-Me-2-Pyr)	4-Ph	4-Cl
1498	CH ₂ CH ₂ (4-OLau-1-Me-2-Pyr)	6-Ph	4-Cl
1499	CH ₂ CH ₂ (4-OLau-1-Me-2-Pyr)	4-OPh	4-Cl
1500	CH ₂ CH ₂ (4-OLau-1-Me-2-Pyr)	6-OPh	4-Cl
1501	CH ₂ CH ₂ (4-OLau-1-Me-2-Pyr)	3, 4- (CH=CH-CH=CH) -	4-Cl
1502	CH ₂ CH ₂ (4-OLau-1-Me-2-Pyr)	4, 5- (CH=CH-CH=CH) -	4-Cl
1503	CH ₂ CH ₂ (4-OLau-1-Me-2-Pyr)	5, 6- (CH=CH-CH=CH) -	4-Cl
1504	CH ₂ CH ₂ NMe ₂	4-Ph	4-Br
1505	CH ₂ CH ₂ (2-Pyr)	4-Ph	4-Br
1506	CH ₂ CH ₂ (2-Pyr)	6-Ph	4-Br
1507	CH ₂ CH ₂ (2-Pyr)	4-OPh	4-Br
1508	CH ₂ CH ₂ (1-Me-2-Pyr)	4-Ph	4-Br
1509	CH ₂ CH ₂ (1-Me-2-Pyr)	6-Ph	4-Br
1510	CH ₂ CH ₂ (1-Me-2-Pyr)	4-OPh	4-Br
1511	CH ₂ CH ₂ (1-Me-2-Pyr)	4, 5- (CH=CH-CH=CH) -	4-Br
1512	CH ₂ CH ₂ (4-OH-1-Me-2-Pyr)	4-Ph	4-Br
1513	CH ₂ CH ₂ (4-OH-1-Me-2-Pyr)	6-Ph	4-Br
1514	CH ₂ CH ₂ (4-OH-1-Me-2-Pyr)	4-OPh	4-Br
1515	CH ₂ CH ₂ (4-OLau-1-Me-2-Pyr)	4-OBu	4-Br
1516	CH ₂ CH ₂ (4-OLau-1-Me-2-Pyr)	4-O-CH ₂ C≡CH	4-Br
1517	CH ₂ CH ₂ (4-OLau-1-Me-2-Pyr)	4-Ph	4-Br
1518	CH ₂ CH ₂ (4-OLau-1-Me-2-Pyr)	6-Ph	4-Br
1519	CH ₂ CH ₂ (4-OLau-1-Me-2-Pyr)	4-OPh	4-Br
1520	CH ₂ CH ₂ (4-OLau-1-Me-2-Pyr)	6-OPh	4-Br
1521	CH ₂ CH ₂ (4-OLau-1-Me-2-Pyr)	4, 5- (CH=CH-CH=CH) -	4-Br
1522	CH ₂ CH ₂ NMe ₂	4-Ph	2, 4-diF
1523	CH ₂ CH ₂ (2-Pyr)	4-Ph	2, 4-diF
1524	CH ₂ CH ₂ (2-Pyr)	6-Ph	2, 4-diF
1525	CH ₂ CH ₂ (2-Pyr)	4-OPh	2, 4-diF
1526	CH ₂ CH ₂ (1-Me-2-Pyr)	4-Ph	2, 4-diF
1527	CH ₂ CH ₂ (1-Me-2-Pyr)	6-Ph	2, 4-diF
1528	CH ₂ CH ₂ (1-Me-2-Pyr)	4-OPh	2, 4-diF
1529	CH ₂ CH ₂ (1-Me-2-Pyr)	4, 5- (CH=CH-CH=CH) -	2, 4-diF
1530	CH ₂ CH ₂ (4-OH-1-Me-2-Pyr)	4-Ph	2, 4-diF
1531	CH ₂ CH ₂ (4-OH-1-Me-2-Pyr)	6-Ph	2, 4-diF
1532	CH ₂ CH ₂ (4-OH-1-Me-2-Pyr)	4-OPh	2, 4-diF
1533	CH ₂ CH ₂ (4-OLau-1-Me-2-Pyr)	4-OBu	2, 4-diF
1534	CH ₂ CH ₂ (4-OLau-1-Me-2-Pyr)	4-O-CH ₂ C≡CH	2, 4-diF

1535	CH ₂ CH ₂ (4-OLau-1-Me-2-Pyr)	4-Ph	2, 4-diF
1536	CH ₂ CH ₂ (4-OLau-1-Me-2-Pyr)	6-Ph	2, 4-diF
1537	CH ₂ CH ₂ (4-OLau-1-Me-2-Pyr)	4-OPh	2, 4-diF
1538	CH ₂ CH ₂ (4-OLau-1-Me-2-Pyr)	6-OPh	2, 4-diF
1439	CH ₂ CH ₂ (4-OLau-1-Me-2-Pyr)	4, 5- (CH=CH-CH=CH) -	2, 4-diF
1540	CH ₂ CH ₂ NMe ₂	4-Ph	3, 4-diF
1541	CH ₂ CH ₂ (2-Pyr)	4-Ph	3, 4-diF
1542	CH ₂ CH ₂ (2-Pyr)	6-Ph	3, 4-diF
1543	CH ₂ CH ₂ (2-Pyr)	4-OPh	3, 4-diF
1544	CH ₂ CH ₂ (1-Me-2-Pyr)	4-Ph	3, 4-diF
1545	CH ₂ CH ₂ (1-Me-2-Pyr)	6-Ph	3, 4-diF
1546	CH ₂ CH ₂ (1-Me-2-Pyr)	4-OPh	3, 4-diF
1547	CH ₂ CH ₂ (1-Me-2-Pyr)	4, 5- (CH=CH-CH=CH) -	3, 4-diF
1548	CH ₂ CH ₂ (4-OH-1-Me-2-Pyr)	4-Ph	3, 4-diF
1549	CH ₂ CH ₂ (4-OH-1-Me-2-Pyr)	6-Ph	3, 4-diF
1550	CH ₂ CH ₂ (4-OH-1-Me-2-Pyr)	4-OPh	3, 4-diF
1551	CH ₂ CH ₂ (4-OLau-1-Me-2-Pyr)	4-OBu	3, 4-diF
1552	CH ₂ CH ₂ (4-OLau-1-Me-2-Pyr)	4-O-CH ₂ C≡CH	3, 4-diF
1553	CH ₂ CH ₂ (4-OLau-1-Me-2-Pyr)	4-Ph	3, 4-diF
1554	CH ₂ CH ₂ (4-OLau-1-Me-2-Pyr)	6-Ph	3, 4-diF
1555	CH ₂ CH ₂ (4-OLau-1-Me-2-Pyr)	4-OPh	3, 4-diF
1556	CH ₂ CH ₂ (4-OLau-1-Me-2-Pyr)	6-OPh	3, 4-diF
1557	CH ₂ CH ₂ (4-OLau-1-Me-2-Pyr)	4, 5- (CH=CH-CH=CH) -	3, 4-diF
1558	CH ₂ CH ₂ NMe ₂	4-Ph	3, 4-diOMe
1559	CH ₂ CH ₂ (2-Pyr)	4-Ph	3, 4-diOMe
1561	CH ₂ CH ₂ (2-Pyr)	4-OPh	3, 4-diOMe
1562	CH ₂ CH ₂ (1-Me-2-Pyr)	4-Ph	3, 4-diOMe
1563	CH ₂ CH ₂ (1-Me-2-Pyr)	6-Ph	3, 4-diOMe
1564	CH ₂ CH ₂ (1-Me-2-Pyr)	4-OPh	3, 4-diOMe
1565	CH ₂ CH ₂ (1-Me-2-Pyr)	4, 5- (CH=CH-CH=CH) -	3, 4-diOMe
1566	CH ₂ CH ₂ (4-OH-1-Me-2-Pyr)	4-Ph	3, 4-diOMe
1567	CH ₂ CH ₂ (4-OH-1-Me-2-Pyr)	6-Ph	3, 4-diOMe
1568	CH ₂ CH ₂ (4-OH-1-Me-2-Pyr)	4-OPh	3, 4-diOMe
1569	CH ₂ CH ₂ (4-OLau-1-Me-2-Pyr)	4-OBu	3, 4-diOMe
1570	CH ₂ CH ₂ (4-OLau-1-Me-2-Pyr)	4-O-CH ₂ C≡CH	3, 4-diOMe
1571	CH ₂ CH ₂ (4-OLau-1-Me-2-Pyr)	4-Ph	3, 4-diOMe
1572	CH ₂ CH ₂ (4-OLau-1-Me-2-Pyr)	6-Ph	3, 4-diOMe
1573	CH ₂ CH ₂ (4-OLau-1-Me-2-Pyr)	4-OPh	3, 4-diOMe
1574	CH ₂ CH ₂ (4-OLau-1-Me-2-Pyr)	6-OPh	3, 4-diOMe
1575	CH ₂ CH ₂ (4-OLau-1-Me-2-Pyr)	4, 5- (CH=CH-CH=CH) -	3, 4-diOMe
1576	CH ₂ CH ₂ CH ₂ NH ₂	4-OC	H
1577	CH ₂ CH ₂ CH ₂ NH ₂	4-OPh	H
1578	CH ₂ CH ₂ CH ₂ NH ₂	4-CH ₂ CH=CH	H
1579	CH ₂ CH ₂ CH ₂ NH ₂	4-O-CH ₂ C≡CH	H
1580	CH ₂ CH ₂ CH ₂ NH ₂	4-Ph	H
1581	CH ₂ CH ₂ CH ₂ NH ₂	5-Ph	H
1582	CH ₂ CH ₂ CH ₂ NH ₂	6-OPh	H
1583	CH ₂ CH ₂ CH ₂ NH ₂	4- (4-Cl-Ph)	H
1584	CH ₂ CH ₂ CH ₂ NH ₂	4, 5- (CH=CH-CH=CH) -	H
1585	CH ₂ CH ₂ CH ₂ NHMe	4-Hp	H

1586	CH ₂ CH ₂ CH ₂ NHMe	4-CH ₂ C≡CH	H
1587	CH ₂ CH ₂ CH ₂ NHMe	4-OHp	H
1588	CH ₂ CH ₂ CH ₂ NHMe	4-Ph	H
1589	CH ₂ CH ₂ CH ₂ NHMe	4-(4-F-Ph)	H
1590	CH ₂ CH ₂ CH ₂ NHMe	4-(4-OMe-Ph)	H
1591	CH ₂ CH ₂ CH ₂ NHMe	4-OPh	H
1592	CH ₂ CH ₂ CH ₂ NMe ₂	4-Oc	H
1593	CH ₂ CH ₂ CH ₂ NMe ₂	4-CF ₃	H
1594	CH ₂ CH ₂ CH ₂ NMe ₂	4-OH	H
1595	CH ₂ CH ₂ CH ₂ NMe ₂	4-OBu	H
1596	CH ₂ CH ₂ CH ₂ NMe ₂	4-OHp	H
1597	CH ₂ CH ₂ CH ₂ NMe ₂	4-OOc	H
1598	CH ₂ CH ₂ CH ₂ NMe ₂	4-OCF ₃	H
1599	CH ₂ CH ₂ CH ₂ NMe ₂	4-CH ₂ CH=CH ₂	H
1600	CH ₂ CH ₂ CH ₂ NMe ₂	4-O-CH ₂ CH=CH ₂	H
1601	CH ₂ CH ₂ CH ₂ NMe ₂	4-CH ₂ C≡CH	H
1602	CH ₂ CH ₂ CH ₂ NMe ₂	4-O-CH ₂ C≡CH	H
1603	CH ₂ CH ₂ CH ₂ NMe ₂	4-Ph	H
1604	CH ₂ CH ₂ CH ₂ NMe ₂	5-Ph	H
1605	CH ₂ CH ₂ CH ₂ NMe ₂	6-Ph	H
1606	CH ₂ CH ₂ CH ₂ NMe ₂	4-(4-Me-Ph)	H
1607	CH ₂ CH ₂ CH ₂ NMe ₂	4-(4-OMe-Ph)	H
1608	CH ₂ CH ₂ CH ₂ NMe ₂	4-(4-F-Ph)	H
1609	CH ₂ CH ₂ CH ₂ NMe ₂	4-(4-Cl-Ph)	H
1610	CH ₂ CH ₂ CH ₂ NMe ₂	6-(4-Me-Ph)	H
1611	CH ₂ CH ₂ CH ₂ NMe ₂	6-(4-OMe-Ph)	H
1612	CH ₂ CH ₂ CH ₂ NMe ₂	6-(4-F-Ph)	H
1613	CH ₂ CH ₂ CH ₂ NMe ₂	6-(4-Cl-Ph)	H
1614	CH ₂ CH ₂ CH ₂ NMe ₂	4-OPh	H
1615	CH ₂ CH ₂ CH ₂ NMe ₂	5-OPh	H
1616	CH ₂ CH ₂ CH ₂ NMe ₂	6-OPh	H
1617	CH ₂ CH ₂ CH ₂ NMe ₂	4-O-(4-Me-Ph)	H
1618	CH ₂ CH ₂ CH ₂ NMe ₂	4-O-(4-OMe-Ph)	H
1 6 1 9	CH ₂ CH ₂ CH ₂ NMe ₂	4-O-(4-F-Ph)	H
1620	CH ₂ CH ₂ CH ₂ NMe ₂	4-O-(4-Cl-Ph)	H
1621	CH ₂ CH ₂ CH ₂ NMe ₂	6-O-(4-Me-Ph)	H
1622	CH ₂ CH ₂ CH ₂ NMe ₂	6-O-(4-OMe-Ph)	H
1623	CH ₂ CH ₂ CH ₂ NMe ₂	6-O-(4-F-Ph)	H
1624	CH ₂ CH ₂ CH ₂ NMe ₂	6-O-(4-Cl-Ph)	H
1625	CH ₂ CH ₂ CH ₂ NMe ₂	3, 4-(CH=CH-CH=CH)-	H
1626	CH ₂ CH ₂ CH ₂ NMe ₂	4, 5-(CH=CH-CH=CH)-	H
1627	CH ₂ CH ₂ CH ₂ NMe ₂	5, 6-(CH=CH-CH=CH)-	H
1628	CH ₂ CH ₂ CH ₂ NMe ₂	4-Oc	3-OMe
1629	CH ₂ CH ₂ CH ₂ NMe ₂	4-Hp	3-OMe
1630	CH ₂ CH ₂ CH ₂ NMe ₂	4-OOc	3-OMe
1631	CH ₂ CH ₂ CH ₂ NMe ₂	4-Ph	3-OMe
1632	CH ₂ CH ₂ CH ₂ NMe ₂	5-Ph	3-OMe
1633	CH ₂ CH ₂ CH ₂ NMe ₂	4-(4-Cl-Ph)	3-OMe
1634	CH ₂ CH ₂ CH ₂ NMe ₂	4-(4-F-Ph)	3-OMe
1635	CH ₂ CH ₂ CH ₂ NMe ₂	4-OPh	3-OMe

1636	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NMe}_2$	4, 5-(CH=CH-CH=CH)-	3-OMe
1637	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NMe}_2$	4-Hp	3-F
1638	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NMe}_2$	4-Ph	3-Cl
1639	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NMe}_2$	4-Ph	4-F
1640	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NMe}_2$	4-(4-OMe-Ph)	3, 5-di-OMe
1641	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NMe}_2$	4-(4-Cl-Ph)	2, 5-di-Cl
1642	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NMe}_2$	4-(4-Cl-Ph)	3-OMe
1643	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NMe}_2$	4-(4-F-Ph)	3-Me
1644	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NMe}_2$	4-OPh	3-CN
1645	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NMe}_2$	4-Ph	3-OMe, 4-F
1646	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NMeEt}$	4-OH	H
1647	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NMeEt}$	4-OOc	H
1648	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NMeEt}$	4-CH ₂ CH=CH ₂	H
1649	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NMeEt}$	4-Ph	H
1650	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NMeEt}$	5-Ph	H
1651	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NMeEt}$	6-Ph	H
1652	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NMeEt}$	4-(4-Cl-Ph)	H
1653	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NMeEt}$	4-(4-F-Ph)	H
1654	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NMeEt}$	4-(4-Me-Ph)	H
1655	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NMeEt}$	4-(4-OMe-Ph)	H
1656	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NMeEt}$	4-OPh	H
1657	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NMeEt}$	5-OPh	H
1658	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NMeEt}$	3, 4-(CH=CH-CH=CH)-	3-OMe
1659	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NMeEt}$	4, 5-(CH=CH-CH=CH)-	4-Br
1660	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NMeEt}$	4-Ph	4-F
1661	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NMeEt}$	4-(4-F-Ph)	2, 4-di-Cl
1662	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NMeEt}$	4-OC	3-Br
1663	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NMeEt}$	6-OPh	H
1664	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NHBu}^t$	4-Ph	2, 5-di-Cl
1665	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NHBu}^t$	4-OC	3-OMe
1666	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NHBu}^t$	4-OPh	3-F
1667	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NHBu}^t$	4-(4-Br-Ph)	H
1668	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NHBu}^t$	3, 4-(CH=CH-CH=CH)-	4-OMe
1669	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NHBu}^t$	4-O-(4-F-Ph)	3, 4-di-OMe
1670	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NHBu}^t$	4-(4-F-Ph)	3, 4-di-OH
1671	$(\text{CH}_2)_4\text{NH}_2$	4-OBu	H
1672	$(\text{CH}_2)_4\text{NH}_2$	4-Ph	H
1673	$(\text{CH}_2)_4\text{NH}_2$	5-Ph	H
1674	$(\text{CH}_2)_4\text{NH}_2$	3, 4-(CH=CH-CH=CH)-	3-Br
1675	$(\text{CH}_2)_4\text{NH}_2$	4-CH ₂ CH=CH ₂	3-Me
1676	$(\text{CH}_2)_4\text{NH}_2$	4-OPh	4-Cl
1677	$(\text{CH}_2)_4\text{NH}_2$	6-Me	2, 4-di-Me
1678	$(\text{CH}_2)_4\text{NH}_2$	4-OC	3-Br
1679	$(\text{CH}_2)_4\text{NMe}_2$	4-OBu	H
1680	$(\text{CH}_2)_4\text{NMe}_2$	4-OC	H
1681	$(\text{CH}_2)_4\text{NMe}_2$	4-CH ₂ CH=CH ₂	H
1682	$(\text{CH}_2)_4\text{NMe}_2$	4-CH ₂ C≡CH	H
1683	$(\text{CH}_2)_4\text{NMe}_2$	4-Ph	H
1684	$(\text{CH}_2)_4\text{NMe}_2$	5-Ph	H
1685	$(\text{CH}_2)_4\text{NMe}_2$	4-Hp	H

1686	(CH ₂) ₄ NMe ₂	4-OPh	H
1687	(CH ₂) ₄ NMe ₂	6-OPh	H
1688	(CH ₂) ₄ NMe ₂	3, 4-(CH=CH-CH=CH)-	H
1689	(CH ₂) ₄ NMe ₂	4, 5-(CH=CH-CH=CH)-	H
1690	(CH ₂) ₄ NMe ₂	5, 6-(CH=CH-CH=CH)-	H
1691	(CH ₂) ₄ NMe ₂	4-CF ₃	H
1692	(CH ₂) ₄ NMe ₂	4-OOc	3-OMe
1693	(CH ₂) ₄ NMe ₂	4-O-CH ₂ CH=CH ₂	4-F
1694	(CH ₂) ₄ NMe ₂	4-CH ₂ CH=CH ₂	2, 4-di-Cl
1695	(CH ₂) ₄ NMe ₂	4-Ph	3, 4, 5-tri-Cl
1696	(CH ₂) ₄ NMe ₂	4-Ph	2, 6-di-Cl
1697	(CH ₂) ₄ NMe ₂	5-Ph	2-OMe
1698	(CH ₂) ₄ NMe ₂	4-OPh	4-Br
1699	(CH ₂) ₄ NMe ₂	4-OPh	3-Cl
1700	(CH ₂) ₄ NMe ₂	3, 4-(CH=CH-CH=CH)-	2, 4, 6-tri-OMe
1701	(CH ₂) ₄ NMe ₂	4, 5-(CH=CH-CH=CH)-	2-Me
1702	(CH ₂) ₄ NMe ₂	5, 6-(CH=CH-CH=CH)-	2-OMe
1703	CH ₂ CH ₂ CH ₂ NHPr ⁱ	4-OC	H
1704	CH ₂ CH ₂ CH ₂ NHPr ⁱ	4-CF ₃	H
1706	CH ₂ CH ₂ CH ₂ NHPr ⁱ	4-OBu	H
1707	CH ₂ CH ₂ CH ₂ NHPr ⁱ	4-OPh	H
1708	CH ₂ CH ₂ CH ₂ NHPr ⁱ	4-OOc	H
1709	CH ₂ CH ₂ CH ₂ NHPr ⁱ	4-OCF ₃	H
1710	CH ₂ CH ₂ CH ₂ NHPr ⁱ	4-CH ₂ CH=CH ₂	H
1711	CH ₂ CH ₂ CH ₂ NHPr ⁱ	4-O-CH ₂ CH=CH ₂	H
1712	CH ₂ CH ₂ CH ₂ NHPr ⁱ	4-CH ₂ C≡CH	H
1713	CH ₂ CH ₂ CH ₂ NHPr ⁱ	4-O-CH ₂ C≡CH	H
1714	CH ₂ CH ₂ CH ₂ NHPr ⁱ	4-Ph	H
1715	CH ₂ CH ₂ CH ₂ NHPr ⁱ	5-Ph	H
1716	CH ₂ CH ₂ CH ₂ NHPr ⁱ	6-Ph	H
1717	CH ₂ CH ₂ CH ₂ NHPr ⁱ	4-(4-Me-Ph)	H
1718	CH ₂ CH ₂ CH ₂ NHPr ⁱ	4-(4-OMe-Ph)	H
1719	CH ₂ CH ₂ CH ₂ NHPr ⁱ	4-(4-F-Ph)	H
1720	CH ₂ CH ₂ CH ₂ NHPr ⁱ	4-(4-Cl-Ph)	H
1721	CH ₂ CH ₂ CH ₂ NHPr ⁱ	6-(4-Me-Ph)	H
1722	CH ₂ CH ₂ CH ₂ NHPr ⁱ	6-(4-OMe-Ph)	H
1723	CH ₂ CH ₂ CH ₂ NHPr ⁱ	6-(4-F-Ph)	H
1724	CH ₂ CH ₂ CH ₂ NHPr ⁱ	6-(4-Cl-Ph)	H
1725	CH ₂ CH ₂ CH ₂ NHPr ⁱ	4-OPh	H
1726	CH ₂ CH ₂ CH ₂ NHPr ⁱ	5-OPh	H
1727	CH ₂ CH ₂ CH ₂ NHPr ⁱ	6-OPh	H
1728	CH ₂ CH ₂ CH ₂ NHPr ⁱ	4-O-(4-Me-Ph)	H
1729	CH ₂ CH ₂ CH ₂ NHPr ⁱ	4-O-(4-OMe-Ph)	H
1730	CH ₂ CH ₂ CH ₂ NHPr ⁱ	4-O-(4-F-Ph)	H
1731	CH ₂ CH ₂ CH ₂ NHPr ⁱ	4-O-(4-Cl-Ph)	H
1732	CH ₂ CH ₂ CH ₂ NHPr ⁱ	6-O-(4-Me-Ph)	H
1733	CH ₂ CH ₂ CH ₂ NHPr ⁱ	6-O-(4-OMe-Ph)	H
1734	CH ₂ CH ₂ CH ₂ NHPr ⁱ	6-O-(4-F-Ph)	H
1735	CH ₂ CH ₂ CH ₂ NHPr ⁱ	6-O-(4-Cl-Ph)	H
1736	CH ₂ CH ₂ CH ₂ NHPr ⁱ	3, 4-(CH=CH-CH=CH)-	H

1737	CH ₂ CH ₂ CH ₂ NHPr ⁱ	4, 5-(CH=CH-CH=CH)-	H
1738	CH ₂ CH ₂ CH ₂ NHPr ⁱ	5, 6-(CH=CH-CH=CH)-	H
1739	CH ₂ CH ₂ CH ₂ NHPr ⁱ	4-0c	3-OMe
1740	CH ₂ CH ₂ CH ₂ NHPr ⁱ	4-Hp	3-OMe
1741	CH ₂ CH ₂ CH ₂ NHPr ⁱ	4-00c	3-OMe
1742	CH ₂ CH ₂ CH ₂ NHPr ⁱ	4-Ph	3-OMe
1743	CH ₂ CH ₂ CH ₂ NHPr ⁱ	5-Ph	3-OMe
1744	CH ₂ CH ₂ CH ₂ NHPr ⁱ	4-(4-Cl-Ph)	3-OMe
1745	CH ₂ CH ₂ CH ₂ NHPr ⁱ	4-(4-F-Ph)	3-OMe
1746	CH ₂ CH ₂ CH ₂ NHPr ⁱ	4-OPh	3-OMe
1747	CH ₂ CH ₂ CH ₂ NHPr ⁱ	4, 5-(CH=CH-CH=CH)-	3-OMe
1748	CH ₂ CH ₂ CH ₂ NHPr ⁱ	4-0c	4-OMe
1749	CH ₂ CH ₂ CH ₂ NHPr ⁱ	4-Hp	3-F
1750	CH ₂ CH ₂ CH ₂ NHPr ⁱ	4-Ph	3-Cl
1751	CH ₂ CH ₂ CH ₂ NHPr ⁱ	4-Ph	4-F
1752	CH ₂ CH ₂ CH ₂ NHPr ⁱ	4-(4-OMe-Ph)	3, 5-di-OMe
1753	CH ₂ CH ₂ CH ₂ NHPr ⁱ	4-(4-Cl-Ph)	2, 5-di-Cl
1754	CH ₂ CH ₂ CH ₂ NHPr ⁱ	4-(4-F-Ph)	3-Me
1755	CH ₂ CH ₂ CH ₂ NHPr ⁱ	4-OPh	3-CN
1756	CH ₂ CH ₂ CH ₂ NHPr ⁱ	4-Ph	3-OMe, 4-F

上記表中、略号は以下の意味を示す。

【0042】

A c : アセチル基

B u : ブチル基

B u^t : t-ブチル基

D e c : デカノイル基

E t : エチル基

H p : ヘプチル基

L a u : ラウロイル基

M e : メチル基

M y r : ミリストイル基

O c : オクチル基

P a l : パルミトイル基

P h : フェニル基

P i p : ピペリジニル基

P rⁱ : イソプロピル基

P y r : ピロリジニル基

S u c : スクシニル基。

【0043】このらの化合物のうち、好適には、化合物番号44、65、70、71、97、118、126、143、151、153、155、156、158、159、160、161、185、246、248、251、252、253、254、283、305、323、350、400、414、470、498、550、559、571、576、577、603、661、665、666、667、754、760、811、829、856、906、920、1004、1033、1051、1115、1133、1326、1337、1389、1603、1606、1607、16

08、1609、1631、1640、1645、1649、1683及び1714の化合物を挙げることができ、更に好適には、化合物番号65、71、97、143、155、158、159、160、161、246、248、251、252、253、254、283、350、414、498、571、661、665、666、667、754、1004、1051、1133、1603、1606、1607、1608、1609、1631、1640、1645、1649及び1683の化合物を挙げることができ、更により好適には、化合物番号155、158、159、160、161、248、253、254、283、498、661、665、666、667、754、1051、1133、1603、1607、1608、1609、1631、1640、1645及び1683の化合物を挙げることができ、特に好適には、

化合物番号155：1-メチル-2-[2-[4-フェニル-2-(2-フェニルエチル)フェノキシ]エチル]ピロリジン、

化合物番号160：2-[2-[4-(4-フルオロフェニル)-2-(2-フェニルエチル)フェノキシ]エチル]-1-メチルピロリジン、

化合物番号161：2-[2-[4-(4-クロロフェニル)-2-(2-フェニルエチル)フェノキシ]エチル]-1-メチルピロリジン、

化合物番号661：2-[2-[2-(3-メトキシフェニル)エチル-4-フェニル]フェノキシ]エチル-1-メチルピロリジン、

化合物番号1051：2-[2-[2-[2-(4-フ

ルオロフェニル) エチル] -4-フェニル] フェノキシ] エチル-1-メチルピロリジン、
 化合物番号1133: 2-[2-[2-(4-フルオロ-3-メトキシフェニル) エチル] -4-フェニル] フェノキシ] エチル-1-メチルピロリジン、
 化合物番号1603: N, N-ジメチル-3-[4-フェニル-2-(2-フェニルエチル) フェノキシ] プロピルアミン、
 化合物番号1631: N, N-ジメチル-3-[2-[2-(3-メトキシフェニル) エチル-4-フェニル] フェノキシ] プロピルアミン、
 化合物番号1640: N, N-ジメチル-3-[2-[2-(4-フルオロフェニル) エチル-4-フェニル]

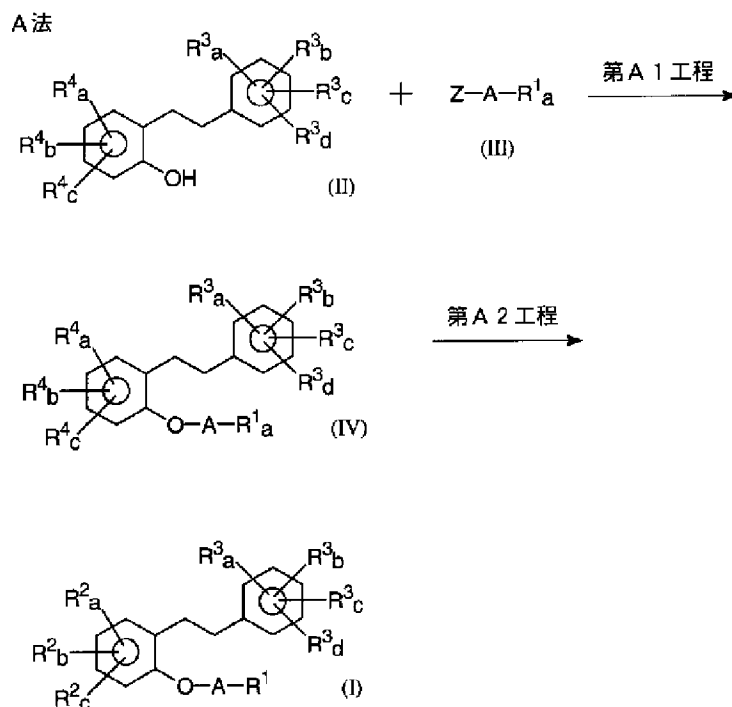
ル] フェノキシ] プロピルアミン、
 化合物番号1645: N, N-ジメチル-3-[2-[2-(4-フルオロ-3-メトキシフェニル) エチル-4-フェニル] フェノキシ] プロピルアミン及び
 化合物番号1683: N, N-ジメチル-4-[4-フェニル-2-(2-フェニルエチル) フェノキシ] ブチルアミン
 の化合物を挙げることができる。

【0044】

【発明の実施の形態】本発明の一般式(I)を有する化合物は、以下の方法に従って容易に製造される。

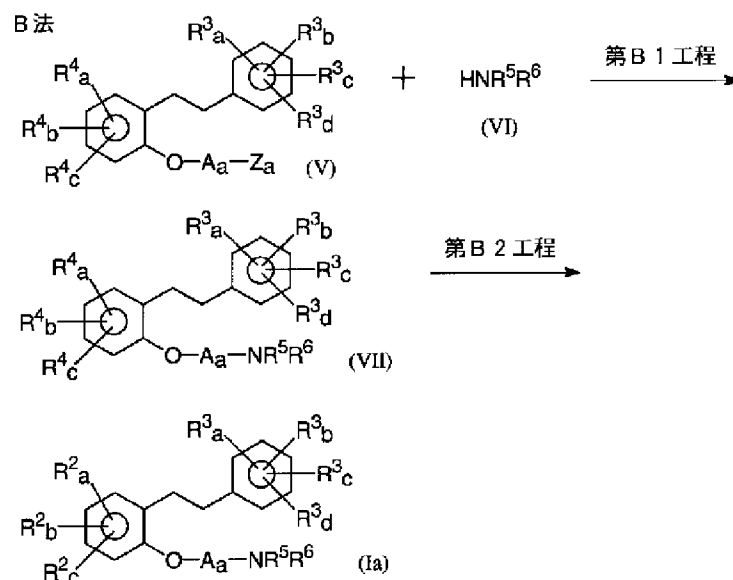
【0045】

【化4】



【0046】

【化5】



【0047】上記式中、 R^1 、 R^2a 、 R^2b 、 R^2c 、 R^3a 、 R^3b 、 R^3c 、 R^3d 及びAは、前述したものと同意義を示し、 R^1a は、保護されたアミノ基、保護されたモノ- C_1-C_6 アルキルアミノ基、ジ- C_1-C_6 アルキルアミノ基又は置換されてもよい、窒素、酸素及び硫黄原子からなる群から選択されるヘテロ原子を1乃至2個含む3乃至6員環状飽和ヘテロシクリル基（該置換基は、炭素原子上の置換基としては、保護されたヒドロキシ基、 C_1-C_{20} アルコキシカルボニルオキシ基、 C_1-C_{20} アルカノイルオキシ基、カルバモイルオキシ基又はモノ-若しくはジ- C_1-C_6 アルキルカルバモイルオキシ基であり、また環の窒素原子が保護されている。）を示し、 R^4a 、 R^4b 及び R^4c は、ヒドロキシが保護されている他、それぞれ、 R^2a 、 R^2b 及び R^2c と同意義を示し、 R^5 及び R^6 は、同一又は異なって、水素原子又は C_1-C_6 アルキル基を示し、Aaは、 C_1-C_6 アルキレン基を示し、Zは、ヒドロキシ基、ハロゲン原子（好適には、塩素、臭素又は沃素原子）、 C_1-C_6 アルカンスルホニルオキシ基（好適には、メタンスルホニルオキシ又はエタンスルホニルオキシ基）又は C_1-C_6 アルキル、 C_1-C_6 アルコキシ若しくはハロゲンで置換されていてもよい C_6-C_{10} アリールスルホニルオキシ基（好適には、ベンゼンスルホニルオキシ又はp-トルエンスルホニルオキシ基）を示し、Zaは、ハロゲン原子（好適には、塩素、臭素または沃素原子）を示す。

【0048】 R^1a 、 R^4a 、 R^4b 、 R^4c 等のヒドロキシ基の保護基は、例えば、テトラヒドロフラニル、テトラヒドロピラニル基のような環状エーテル基、メトキシメチル基、メトキシメトキシメチル基、 C_6-C_{10} アリールメチル基、 C_6-C_{10} アリールメチルオキシカルボニル基であり得、好適には、テトラヒドロピラニル、メトキシメチル、ベンジル、p-メトキシベンジル、p-

ブロムベンジル、ベンジルオキシカルボニル、p-メトキシベンジルオキシカルボニル、p-ブロムベンジルオキシカルボニル基である。

【0049】 R^1a のヘテロシクリル環の窒素原子、アミノ基、モノ- C_1-C_6 アルキルアミノ基等の保護基は、例えば、 C_1-C_6 アルコキシカルボニル基、 C_1-C_6 アルカノイル基、 C_6-C_{10} アリールメチル基、 C_6-C_{10} アリールメチルオキシカルボニル基であり得、好適には、t-ブトキシカルボニル、アセチル、ベンジル、p-メトキシベンジル、p-ブロムベンジル、ベンジルオキシカルボニル、p-メトキシベンジルオキシカルボニル、p-ブロムベンジルオキシカルボニル基である。

【0050】A法は、化合物（I）製造する方法である。

【0051】第A1工程は、一般式（IV）を有する化合物を製造する工程で、一般式（II）を有する化合物と一般式（III）を有する化合物を反応させることにより達成される。

【0052】Zがハロゲン原子、 C_1-C_6 アルカンスルホニルオキシ基又は C_6-C_{10} アリールスルホニルオキシ基を示す場合、本反応は、不活性溶剤中、塩基の存在下に行われる。

【0053】使用される塩基は、好適には、炭酸ナトリウム、炭酸カリウムのようなアルカリ金属炭酸塩、重炭酸ナトリウム、重炭酸カリウムのようなアルカリ金属重炭酸塩、弗化ナトリウム、弗化カリウムのようなアルカリ金属弗化塩、水素化ナトリウム、水素化カリウム、水素化リチウムのようなアルカリ金属水素化物、ナトリウムメトキシド、ナトリウムエトキシド、カリウムt-ブトキシド、リチウムメトキシドのようなアルカリ金属アルコキシド、ピリジン、ピコリン、トリエチルアミン、N-メチルモルホリン、4-ジメチルアミノピリジンのよ

うな有機アミンであり得、さらに好適には、アルカリ金属炭酸塩、アルカリ金属弗化塩、アルカリ金属水素化物又はアルカリ金属アルコキシドである。

【0054】使用される不活性溶剤は、反応に関与しなければ、特に制限されず、例えば、ヘキサン、ベンゼン、トルエンのような炭化水素類、ジクロロメタン、クロロホルム、1, 2-ジクロロエタンのようなハロゲン化炭化水素類、エーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサンのようなエーテル類、アセトン、メチルエチルケトンのようなケトン類、アセトニトリルのようなニトリル類、N, N-ジメチルアセトアミド、N, N-ジメチルホルムアミド、N-メチルピロリドン、ヘキサメチルホスホルアミドのようなアミド類、ジメチルスルホキシドのようなスルホキシド類又はこれらの混合溶剤であり得、好適には、エーテル類、ケトン類、アミド類又はスルホキシド類である。

【0055】反応温度は、原料化合物(II) および(II I)、溶剤並びに塩基の種類により異なるが、通常0℃乃至100℃(好適には、10℃乃至80℃)であり、反応時間は、反応温度等により異なるが、30分間乃至48時間(好適には1乃至24時間)である。

【0056】Zがヒドロキシ基を示す場合、本反応は、不活性溶剤中、トリフェニルホスフィン及びアゾジカルボン酸メチル、アゾジカルボン酸エチルのようなアゾジカルボン酸C₁ - C₄ アルキルエステルの存在下に行われる。

【0057】使用される不活性溶剤は、上記と同様なものをあげることができるが、好適には、芳香族炭化水素類、ハロゲン化炭化水素類又はエーテル類である。

【0058】反応温度は、原料化合物(II) および(II I)、溶剤並びに塩基の種類により異なるが、通常-20℃乃至100℃(好適には、10℃乃至80℃)であり、反応時間は、反応温度等により異なるが、30分間乃至48時間(好適には1乃至24時間)である。

【0059】反応終了後、本反応の目的化合物(IV)は、常法に従って、反応混合物から採取される。例えば、不溶物が存在する場合は、適宜濾去して、溶剤を減圧留去することによって又は溶剤を減圧留去した後、残留物に水を加え、酢酸エチルのような水不混和性有機溶媒で抽出し、無水硫酸マグネシウム等で乾燥後、溶媒を留去することにより得ることができ、必要ならば、常法、例えば、再結晶、カラムクロマトグラフィー等でさらに精製することができる。

【0060】第A2工程は、所望により行う工程であり、

反応(a) : R¹a、R⁴a、R⁴b及び/又はR⁴cに含まれるヒドロキシの保護基を除去する反応、

反応(b) : 反応(a)により生成したヒドロキシ基をアルキル化(アルケニル化、アルキニル化等を含む。)、アシル化又はカルバモイル化する反応

反応(c) : R¹aに含まれる窒素原子、アミノ基等の保護基を除去する反応

反応(d) : R¹aに含まれるアルコキシカルボニル基をメチル基に又はアルカノイル基をアルキル基に変換する反応及び

反応(e) : R¹aに含まれる=NH基をアルキル化する反応

を含み、適宜順序変えて行われる。

【0061】反応(a) : 反応(a)におけるR¹a R⁴a、R⁴b及び/又はR⁴cに含まれるヒドロキシの保護基を除去する反応は、保護基を除去する反応は、保護基の種類により異なり、有機合成化学でよく知られている方法で行われる。

【0062】ヒドロキシ基の保護基がアリーメルメチル基またはアリールメチルオキシカルボニル基である場合には、不活性溶剤(好適には、メタノール、エタノール、イソプロパノールのようなアルコール類、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサンのようなエーテル類、トルエン、ベンゼン、キシレンのような芳香族炭化水素類、ヘキサン、シクロヘキサンのような脂肪族炭化水素類、酢酸エチル、酢酸ブチルのようなエステル類、酢酸のような脂肪酸類又はこれらの有機溶剤と水との混合溶剤)中、接触還元触媒(好適には、パラジウム-炭素、ラネーニッケル、酸化白金、白金黒、ロジウム-酸化アルミニウム、トリフェニルホスフィン-塩化ロジウム、パラジウム-硫酸バリウム等)の存在下、相当する化合物を水素(通常1乃至10気圧、好適には、1乃至3気圧)と反応することにより行われる。

【0063】反応温度は、通常0℃乃至100℃(好適には、20℃乃至80℃)であり、反応時間は、反応温度等により異なるが、通常30分間乃至48時間(好適には1乃至24時間)である。

【0064】ヒドロキシ基の保護基がメトキシメチル基、メトキシメトキシメチル基又は環状エーテル基である場合には、例えば、不活性溶剤(ヘキサン、ベンゼンのような炭化水素類、塩化メチレン、クロロホルムのようなハロゲン化炭化水素類、酢酸エチルのようなエステル類、アセトン、メチルエチルケトンのようなケトン類、メタノール、エタノールのようなアルコール類、エーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサンのようなエーテル類又はこれらの有機溶剤と水との混合溶剤であり、好適には、エステル類、エーテル類、ハロゲン化炭化水素類である。)中、相当する化合物を酸(例えば、塩化水素、硝酸、塩酸、硫酸のような無機酸、酢酸、トリフルオロ酢酸、メタンスルホン酸、p-トルエンスルホン酸のような有機酸、三弗化ホウ素のようなルイス酸、ダウエックス50W(登録商標)のような強酸性の陽イオン交換樹脂等であり、好適には、無機酸及び有機酸であり、更に好適には、塩酸、硫酸、トリフルオロ酢酸である。)と反応することにより行われる。

【0065】反応温度は、通常 -10°C 乃至 100°C （好適には、 -50°C 乃至 50°C ）で、反応時間は、反応温度等により異なるが、通常5分間乃至48時間（好適には30分間乃至10時間）である。

【0066】また、ヒドロキシ基の保護基の種類を変え、反応条件を選択することによって、 R^1a 、 R^4a 、 R^4b 及び／又は R^4c に含まれるヒドロキシの保護基を選択的に除去することができる。

【0067】反応終了後、本反応の目的化合物は、常法に従って反応混合物から採取される。例えば、反応混合物を適宜中和し、又、不溶物が存在する場合には濾過により除去した後、酢酸エチルのような水と混和しない有機溶媒を加え、水洗後、溶剤を留去することによって得られる。得られた目的化合物は必要ならば、常法、例えば再結晶、再沈殿又はクロマトグラフィー等によって更に精製できる。

【0068】反応（b）：反応（b）におけるヒドロキシ基をアルキル化（アルケニル化、アルキニル化等を含む。）、アシル化又はカルバモイル化する反応は、有機合成化学で周知の方法により行われる。例えば、不活性溶剤（好適には、ベンゼン、トルエンのような芳香族炭化水素類、ジクロルメタン、クロロホルムのようなハロゲン化炭化水素、酢酸エチルのようなエステル類、テトラヒドロフラン、ジオキサンのようなエーテル類、アセトン、メチルエチルケトンのようなケトン類、N、N-ジメチルアセトアミドのようなアミド類）中、塩基存在又は不存在下（塩基は、好適には、トリエチルアミン、ピリジン、ジエチルイソプロピルアミン、4-ジメチルアミノピリジンのような有機三級アミン類）、アルキル化剤（アルケニル化剤、アルキニル化剤等を含む。）、アシル化剤又はカルバモイル化剤を反応させることにより行われる。

【0069】使用されるアルキル化剤（アルケニル化剤、アルキニル化剤等を含む。）、アシル化剤又はカルバモイル化剤としては、臭化若しくは沃化ブチル、臭化ヘプチル、ヨウ化ヘプチル、臭化オクチル、ヨウ化オクチル、ヨウ化ノニル、ヨウ化デシルのような C_7-C_{10} アルキルハライド、臭化アリル、ヨウ化アリル、ヨウ化メタアリル、ヨウ化（2-ブテニル）、ヨウ化（2-ペンテニル）、ヨウ化（2-ヘキセニル）のような C_3-C_6 アルケニルハライド、臭化プロパルギル、ヨウ化プロパルギル、ヨウ化（2-ブチニル）、ヨウ化（2-ペンチニル）、ヨウ化（2-ヘキシニル）のような C_3-C_6 アルキニルハライド、クロロ炭酸メチル、プロモ炭酸メチル、クロロ炭酸エチル、クロロ炭酸プロピル、クロロ炭酸イソプロピル、クロロ炭酸ブチル、クロロ炭酸t-ブチル、クロロ炭酸ペンチル、クロロ炭酸ヘキシル、クロロ炭酸ヘプチル、クロロ炭酸オクチル、クロロ炭酸ノニル、クロロ炭酸デシル、クロロ炭酸ウンデシル、クロロ炭酸ドデシル、クロロ炭酸トリデシル、クロ

ロ炭酸テトラデシルのようなハロゲン炭酸 C_1-C_{14} アルキル、クロロ炭酸フェニル、クロロ炭酸トリル、クロロ炭酸フルオロフェニル、クロロ炭酸クロロフェニル、クロロ炭酸メトキシフェニル、クロロ炭酸ナフチルのようなハロゲン炭酸 C_6-C_{10} アリール、アセチルクロライド、プロピオンクロライド、ブチルクロライド、ブチルプロマイド、イソブチルクロライド、バレリルクロライド、ピパロイルクロライド、ヘキサノイルクロライド、3, 3-ジメチルブチルクロライド、ヘプタノイルクロライド、オクタノイルクロライド、ノナノイルクロライド、デカノイルクロライド、ラウロイルクロライド、ミリスチルクロライド、パルミトイルクロライド、ステアロイルクロライド、エイコサノイルクロライド、ドコサノイルクロライドのような C_2-C_{20} アルカノイルハライド、ギ酸と酢酸の混合酸無水物、無水酢酸、無水プロピオン酸、無水ブタン酸、無水吉草酸、無水ピパリン酸、無水ヘキサノ酸、無水ヘプタン酸、無水オクタン酸、無水ノナン酸、無水デカン酸、無水ラウリン酸、無水ミリスチン酸、無水パルミチン酸のような C_2-C_{20} カルボン酸無水物、無水コハク酸、無水グルタル酸、無水アジピン酸、無水ピメリン酸、無水スベリン酸のような環状酸無水物、イソシアネート、メチルイソシアネート、エチルイソシアネート、ブチルイソシアネート、ヘキシルイソシアネートのような C_1-C_6 アルキルイソシアネートN、N-ジメチルカルバモイルクロリド、N、N-ジエチルカルバモイルクロリド、N、N-ジプロピルカルバモイルクロリド、N、N-ジブチルカルバモイルクロリド、N、N-ジペンチルカルバモイルクロリド、N、N-ジヘキシルカルバモイルクロリドのような C_1-C_6 アルキルカルバモイルハライドを挙げることができる。

【0070】また、ヒドロキシ基をアシル化する反応は、相当するヒドロキシ化合物とカルボン酸（例えば、酢酸、プロピオン酸、ブタン酸、草吉酸、ヘキサノ酸、3, 3-ジメチルブタン酸、ヘプタン酸、オクタン酸、ノナン酸、デカン酸、ラウリン酸、ミリスチン酸、パルミチン酸、ステアリン酸、エイコサン酸、ドコサン酸のような C_2-C_{20} 脂肪族カルボン酸又はt-ブチルマロン酸、t-ブチルコハク酸、t-ブチルグルタル酸、t-ブチルアジピン酸、t-ブチルピメリン酸、t-ブチルスベリン酸のようなジカルボン酸モノアルキル等）を前記第A1工程のZがヒドロキシ基である場合と同様に反応させることによっても行なわれる。また、得られたt-ブチルエステル化合物は、前記本工程の反応（a）と同様に、酸と処理して、目的カルボキシで置換された C_2-C_7 アルカノイルオキシ化合物に導くことができる。

【0071】反応温度は、通常 -10°C 乃至 50°C （好適には、 0°C 乃至 30°C ）であり、反応時間は、反応温

度等により異なるが、通常15分間乃至20時間（好適には、30分間乃至10時間）である。

【0072】反応終了後、反応生成物は、常法により反応混合物から採取することができ、例えば、不溶物が存在する場合は、適宜濾別し、反応液が酸性若しくはアルカリ性の場合は、適宜中和した後、前述した第A1工程の化合物を採取する方法と同様の操作により行われる。

【0073】反応（c）：反応（c）におけるR^{1a}に含まれる窒素原子、アミノ基等の保護基を除去する反応は、保護基の種類により異なり、有機合成化学でよく知られている方法で行われる。

【0074】窒素原子の保護基がアリールメチル基又はアリールメトキシカルボニル基である場合には、前記第A2工程の反応（a）のヒドロキシの保護基がアリールメチル基である場合の除去反応と同様に行なわれる。

【0075】窒素原子の保護基がt-ブトキシカルボニル基である場合には、前記本工程の反応（a）のヒドロキシの保護基がメトキシメチル基等である場合の除去反応と同様に行なわれる。

【0076】さらに、窒素原子の保護基がアルコキシカルボニル残基である場合には、不活性溶剤（好適には、メタノール、エタノールのようなアルコール類、テトラヒドロフラン、ジオキサンのようなエーテル類、水または水と上記有機溶剤との混合溶剤）中、塩基（好適には、水酸化リチウム、水酸化ナトリウム、水酸化カリウムのようなアルカリ金属水酸化物または炭酸ナトリウム、炭酸カリウムのようなアルカリ金属炭酸塩）と、反応させ、加水分解によって、相当する保護基が除去される。

【0077】反応温度は、溶媒等により異なるが、通常0℃乃至100℃（好適には、室温乃至60℃）であり、反応時間は、反応温度等により異なるが、通常30分間乃至24時間（好適には、1時間乃至16時間）である。

【0078】反応終了後、反応生成物は、常法により反応混合物から採取することができ、例えば、前述したA法の本工程の化合物を採取する方法と同様の操作により行なわれる。

【0079】反応（d）：反応（d）におけるR^{1a}に含まれるアルコキシカルボニル基をメチル基に又はアルカノイル基をアルキル基に変換する反応は、不活性溶剤（好適には、エーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサンのようなエーテル類）中、還元剤（好適には、水素化リチウムアルミニウムのようなアルカリ金属水素化アルミニウム）と、反応させることによって行なわれる。

【0080】反応温度は、溶媒等により異なるが、通常0℃乃至100℃（好適には室温乃至80℃）であり、反応時間は、反応温度等により異なるが、通常30分間乃至24時間（好適には、1時間乃至16時間）である。

【0081】反応終了後、反応生成物は、常法により反応混合物から採取することができ、例えば、前述した第A1工程の化合物を採取する方法と同様の操作により行われる。

【0082】反応（e）：反応（e）におけるR^{1a}に含まれる=NH基をアルキル化する反応は、アルキル化剤として、ヨウ化メチル、ヨウ化エチル、ヨウ化プロピル、ヨウ化ブチル、ヨウ化ペンチル、ヨウ化ヘキシルのようなC₁－C₆アルキルハライドを、塩基（例えば、炭酸カリウム、炭酸ナトリウムのようなアルカリ金属炭酸塩；水素化ナトリウムのような水素化アルカリ金属）の存在下に作用させて、前記本工程の反応（b）と同様に行なわれる。

【0083】B法は、化合物（I）において、R¹がアミノ基又はモノー若しくはジ－C₁－C₆アルキルアミノ基である化合物（Ia）を製造する方法である。

【0084】第B1工程は、一般式（VII）を有する化合物を製造する工程で、不活性溶媒中、一般式（V）を有する化合物と一般式（VI）を有する化合物を反応させることにより達成される。

【0085】使用される不活性溶剤は、反応に関与しなければ、特に制限されず、例えば、ヘキサン、ベンゼン、トルエンのような炭化水素類、ジクロルメタン、クロロホルム、1，2－ジクロルエタンのようなハロゲン化炭化水素類、エーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサンのようなエーテル類、アセトン、メチルエチルケトンのようなケトン類、アセトニトリルのようなニトリル類、N，N－ジメチルアセトアミド、N，N－ジメチルホルムアミド、N－メチルピロリドン、ヘキサメチルホスホルアミドのようなアミド類、ジメチルスルホキシドのようなスルホキシド類、水又はこれらの混合溶剤であり得、好適には、エーテル類又は含水エーテル類である。

【0086】反応温度は、原料化合物（V）および（VI）及び溶剤の種類により異なるが、通常0℃乃至150℃（好適には、20℃乃至100℃）であり、反応時間は、反応温度等により異なるが、30分間乃至30時間（好適には1乃至12時間）である。

【0087】反応終了後、本工程の目的化合物は、常法に従って反応混合物から採取される。例えば、反応混合物を適宜中和し、又、不溶物が存在する場合には濾過により除去した後、酢酸エチルのような水と混和しない有機溶媒を加え、水洗後、溶剤を留去することによって得られる。得られた目的化合物は必要ならば、常法、例えば再結晶、再沈殿又はクロマトグラフィー等によって更に精製できる。

【0088】第B2工程では、化合物（Ia）を製造する工程で、所望により、R^{4a}、R^{4b}及び／又はR^{4c}に含まれるヒドロキシの保護基を除去することにより達成され、本反応は、前記第A2工程の反応（a）と同様に行

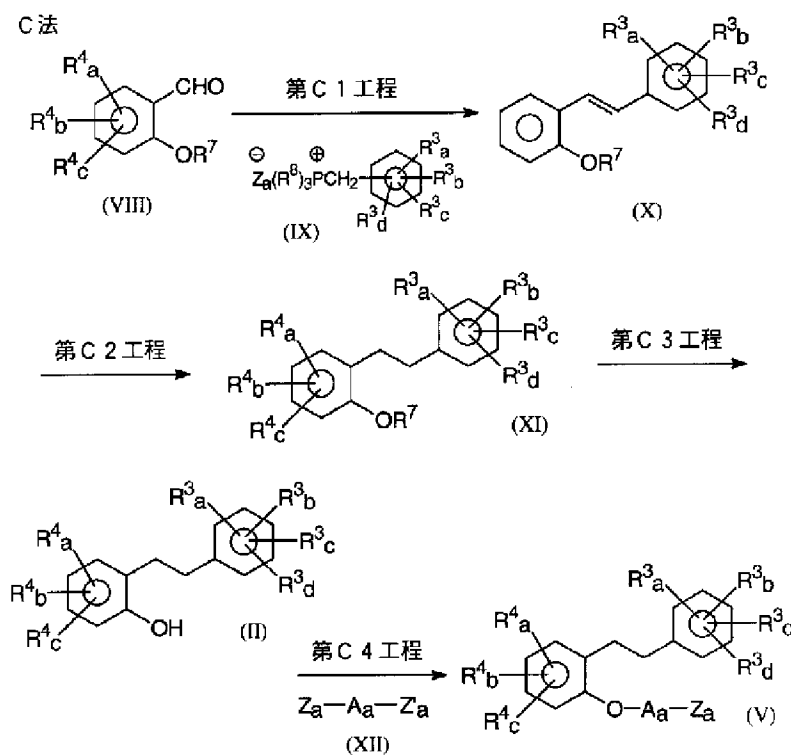
われる。

【0089】また、化合物（I）は、常法に従って、酸で処理することによって薬理上許容し得る塩に変換することができる。例えば、不活性溶剤（好適には、エーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサンのようなエーテル類、メタノール、エタノールのようなアルコール類、メチレンクロリド、クロロホルムのヨウナハロゲン化炭化水素類）中、相当する酸と室温で5分間乃至1時間反応させ、溶剤を減圧で留去することによって得ることができる。また、酸性の樹脂カラム〔例えば、CM-セファデックスC-25（登録商標）等〕に化合物（I）又はその酸付加塩を吸着させ、希塩酸を溶出することによって、塩酸塩を得ることができる。

【0090】原料化合物（II）、（V）及び（III）は、公知であるか公知の方法に従って製造される〔例えば、特開昭55-20740号公報、特開平2-30402号公報、特開平6-234736号公報、特開平6-306025号公報、ジャーナル・オブ・メディシナル・ケミストリー、第33巻、第1頁（1990年）：J. Med. Chem., 33, 1（1990）、ジャーナル・オブ・メディシナル・ケミストリー、第36巻、第3580頁（1993年）：J. Med. Chem., 36, 3580（1993）等〕。又、以下の方法によっても製造される。

【0091】

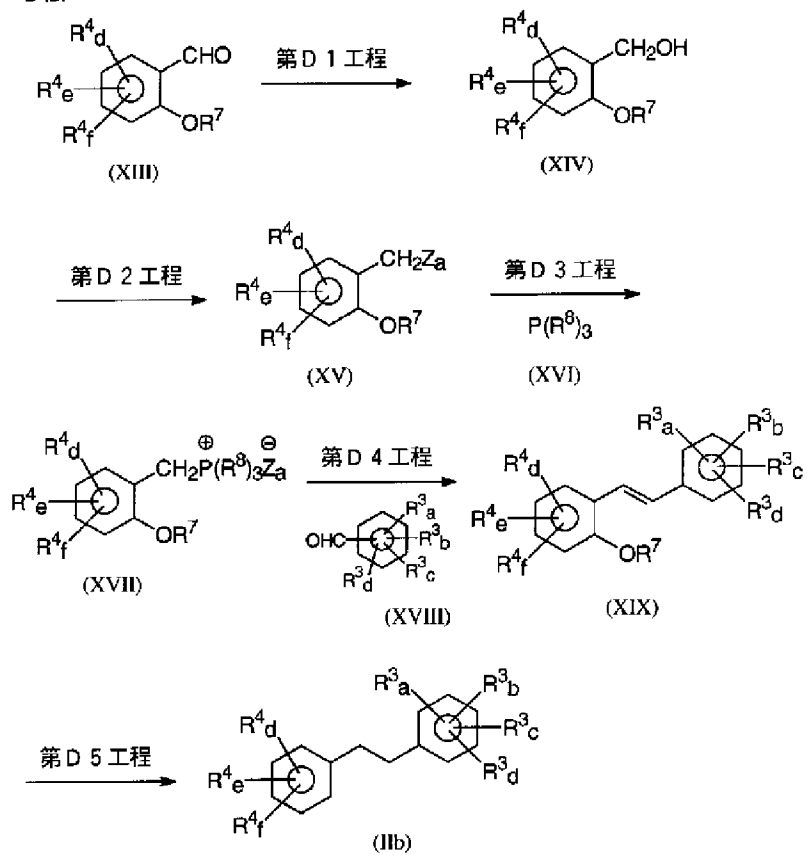
【化6】



【0092】

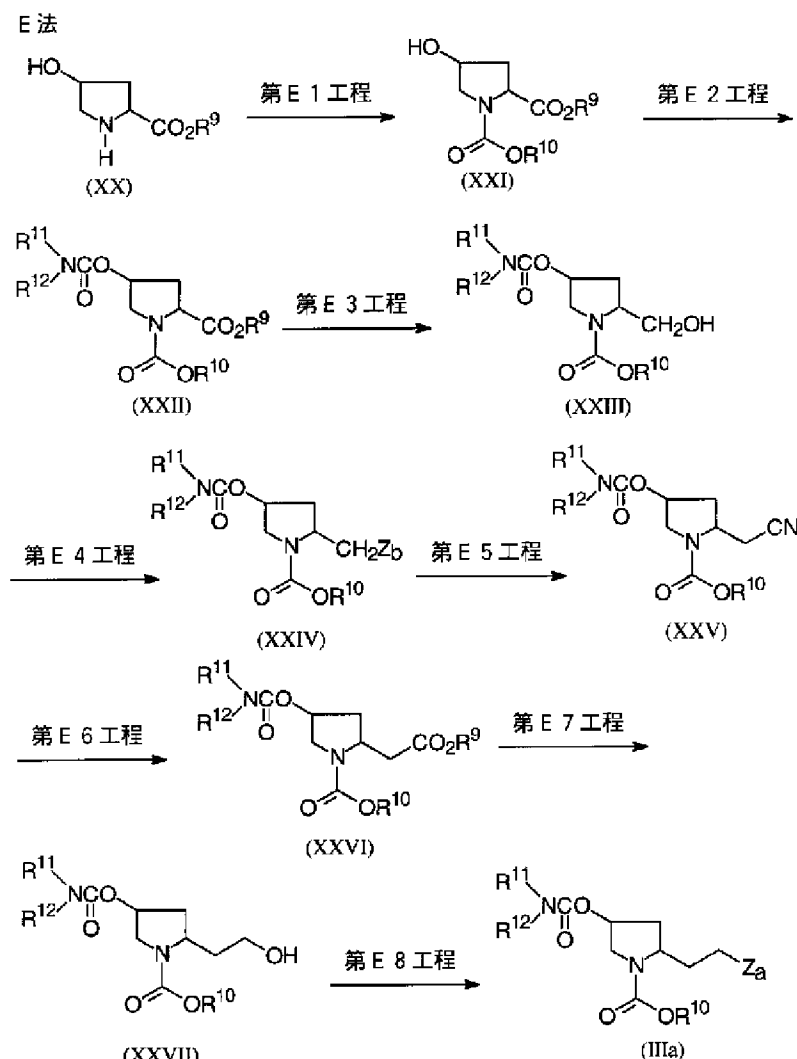
【化7】

D 法



【 0 0 9 3 】

【 化 8 】



【0094】上記式中、 R^3a 、 R^3b 、 R^3c 、 R^3d 、 R^4a 、 R^4b 、 R^4c 、 Aa 及び Za は、前述したものと同意義を示し、 R^4d 及び R^4e は、それらが結合している炭素原子と共に $C_1 - C_6$ アルキル、 $C_1 - C_6$ アルコキシ若しくはハロゲンで置換されていてもよいフェニル環を形成する基を示し、 R^4e は、それらが結合している炭素原子と共に $C_1 - C_6$ アルキル、 $C_1 - C_6$ アルコキシ若しくはハロゲンで置換されていてもよいフェニル環を形成する基を示さない他、 R^4a と同意義を示し、 R^7 は、水素原子又はヒドロキシ基の保護基を示し、 R^8 は、 $C_6 - C_{10}$ アリール基を示し、 R^9 は、 $C_1 - C_6$ アルキル基を示し、 R^{10} は、 $C_1 - C_9$ アルキル基を示し、 R^{11} 及び R^{12} は、同一又は異なって、水素原子又は $C_1 - C_6$ アルキル基を示し、 Za は、ハロゲン原子を示し、 Zb は、ハロゲン原子、 $C_1 - C_6$ アルカンスルホニルオキシ基又は $C_1 - C_6$ アルキル、 $C_1 - C_6$ アルコキシ若しくはハロゲンで置換されていてもよい $C_1 - C_6$ アリールスルホニルオキシ基を示す。

【0095】C法は、化合物(II)及び(V)を製造する方法である。第C 1工程は、一般式(X)を有する化合物を

製造する工程で、不活性溶剤中（例えば、ベンゼン、トルエン、キシレンのような芳香族炭化水素類、エーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサンのようなエーテル類、アセトニトリルのようなニトリル類、N、N-ジメチルアセトアミド、N-メチルピロリドン、ヘキサメチルホスホルアミドのようなアミド類、好適には、ニトリル類）、塩基（例えば、1，8-ジアザビシクロ[5.4.0]ウンデサ-7-エン（DBU）、1，5-ジアザビシクロ[4.3.0]ノナ-5-エン（DBN）のようなアミン類、水酸化ナトリウム、水酸化カリウムのようなアルカリ金属水酸化物、水素化リチウム、水素化ナトリウム、水素化カリウムのようなアルカリ金属水素化物、ナトリウムアミド、カリウムアミドのようなアルカリ金属アミド、ナトリウムメトキシド、ナトリウムエトキシド、カリウム t -ブトキシドのようなアルカリ金属アルコキシド、ブチルリチウム、 s -ブチルリチウムのようなアルキル金属化合物、フェニールリチウムのようなアリール金属化合物、好適には、アミン類、アルカリ金属水素化物、アルカリ金属アルコキシド又はアルキル金属化合物）の存在下、一般式(VIII)を有する化合物

と一般式(IX)を有する化合物を、0℃乃至200℃（好適には、20℃乃至150℃）で、30分間乃至24時間（好適には、1乃至10時間）反応させることにより行われる。

【0096】第C2工程は、一般式(XI)を有する化合物を製造する工程で、化合物(X)を接触還元することにより達成され、本工程は、前記A法第A2工程反応(a)におけるヒドロキシ基の保護基がアリールメチル基等である場合の接触還元による除去反応と同様に行われる。

【0097】第C3工程は、化合物(II)を製造する工程で、化合物(XI)のヒドロキシ基の保護基を除去することにより達成され、本工程は、前記A法第A2工程反応(a)と同様に行われる。

【0098】第C4工程は、化合物(V)を製造する工程で、化合物(II)と一般式(XII)を有する化合物を反応させることにより達成され、本工程は、前記A法第A2工程反応(b)と同様に行われる。又、所望により、前記A法第A2工程反応(a)及び反応(b)と同様に、ヒドロキシ基の保護基の除去及びアルキル化等を行うことができる。

【0099】D法は、化合物(II)において、R^{4a}、R^{4b}等が、それらが結合している炭素原子と共にC₁—C₆アルキル、C₁—C₆アルコキシ若しくはハロゲンで置換されていてもよいフェニル環を形成する基を示す化合物(IIb)を製造する方法である。第D1工程は、一般式(XIV)を有する化合物を製造する工程で、不活性溶剤中（例えば、ベンゼン、トルエン、キシレンのような芳香族炭化水素類、エーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサンのようなエーテル類、アセトニトリルのようなニトリル類、好適には、エーテル類）、一般式(XIII)を有する化合物と還元剤（例えば、水素化リチウムアルミニウム、水素化アルミニウムのような水素化アルミニウム化合物、水素化ホウ素ナトリウム、水素化シアノホウ素ナトリウムのような水素化ホウ素ナトリウム化合物、好適には、水素化アルミニウム化合物）を用い、-10℃乃至100℃（好適には、10℃乃至50℃）で、30分間乃至10時間（好適には、1乃至5時間）反応させることにより行われる。

【0100】第D2工程は、一般式(XV)を有する化合物を製造する工程で、不活性溶剤中（例えば、ベンゼン、トルエン、キシレンのような芳香族炭化水素類、エーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサンのようなエーテル類、アセトニトリルのようなニトリル類、N、N-ジメチルアセトアミド、N-メチルピロリドン、ヘキサメチルホスホルアミドのようなアミド類、好適には、エーテル類）、化合物(XIV)をハロゲン化剤（例えば、塩化チオニル、臭化チオニルのようなハロゲン化チオニル、オキシ塩化リン、オキシ臭化リンのようなオキシハロゲン化リン、三塩化リン、三臭化リン、三沃化リン、五塩化リン、五臭化リンのようなハロゲン化リン、トリフェニ

ルホスフィンジクロリド、トリフェニルホスフィンジブロミド、トリフェニルホスフィンジアイオダイドのようなC₆—C₁₀アリールホスフィンジハライド、トリフェニルホスフィンのようなトリC₆—C₁₀アリールホスフィンと四塩化炭素、四臭化炭素、四沃化炭素のような四ハロゲン化炭素の混合物、トリフェニルホスフィンのようなトリC₆—C₁₀アリールホスフィンとN-クロコハク酸イミド、N-ブロモコハク酸イミドのようなN-ハロゲノコハク酸イミド類の混合物等、好適には、ハロゲン化チオニル、ハロゲン化リン又はC₆—C₁₀アリールホスフィンジハライド、特に好適には、塩化チオニル、三塩化リン、三臭化リン、トリフェニルホスフィンジクロリド、トリフェニルホスフィンジブロミド又はトリフェニルホスフィンジアイオダイド)と、-10℃乃至100℃（好適には、10℃乃至50℃）で、30分間乃至10時間（好適には、1乃至5時間）反応させることにより行われる。

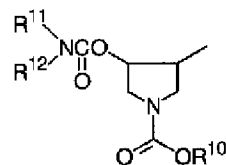
【0101】第D3工程は、一般式(XVII)を有する化合物を製造する工程で、不活性溶剤中（例えば、ベンゼン、トルエン、キシレンのような芳香族炭化水素類、エーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサンのようなエーテル類、アセトニトリルのようなニトリル類、好適には、芳香族炭化水素類）、化合物(XV)と一般式(XVI)を有する化合物を、0℃乃至200℃（好適には、20℃乃至100℃）で、30分間乃至24時間（好適には、1乃至5時間）反応させることにより行われる。

【0102】第D4工程は、一般式(XIX)を有する化合物を製造する工程で、塩基の存在下、化合物(XVII)を一般式(XVIII)を有する化合物と反応させることにより達成され、本工程は、前記C法第C1工程と同様に行われる。

【0103】第D5工程は、化合物(IIb)を製造する工程で、化合物(XIX)を接触還元することにより達成され、本工程は、前記A法第A2工程反応(a)におけるヒドロキシ基の保護基がアリールメチル基等である場合の接触還元による除去反応と同様に行われる。

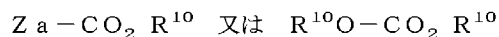
【0104】E法は、化合物(III)において、R^{1a}が、式

【0105】
【化9】



【0106】（式中、R¹⁰、R¹¹及びR¹²は前述したものと同意義を示す。）を有する基であり、Aがエチレン基であり、Zがハロゲン原子である化合物(IIIa)を製造する方法である。第E1工程は、一般式(XXI)を有する

化合物を製造する工程で、塩基の存在下、一般式(XX)を有する化合物を、式



(式中、 R^{10} 及び Za は前述したものと同意義を示す。)を有する化合物と反応させることにより達成され、本工程は、前記A法第A2工程反応(b)におけるアシル化反応と同様に行われる。

【0107】第E2工程は、一般式(XXII)を有する化合物を製造する工程で、化合物(XXI)をカルバモイル化することにより達成され、本工程は、前記A法第A2工程反応(b)におけるカルバモイル反応と同様に行われる。

【0108】第E3工程は、一般式(XXIII)を有する化合物を製造する工程で、化合物(XXII)を還元剤と反応させることにより達成され、本工程は、前記D法第D1工程と同様に行われる。

【0109】第E4工程は、一般式(XXIV)を有する化合物を製造する工程で、化合物(XXIII)をハロゲン化又はスルホニル化することにより達成され、ハロゲン化反応は、前記D法第D2工程と同様に行われる。

【0110】スルホニル化反応は、アシル化剤の代わりに、スルホニル化剤(例えば、メタンスルホニルクロライド、メタンスルホニルプロマイド、エタンスルホニルクロライド、ブタンスルホニルクロライドのような C_1-C_4 アルカンスルホニルハライド、ベンゼンスルホニルクロライド、ベンゼンスルホニルプロマイド、p-トルエンスルホニルクロライド、ナフタレンスルホニルクロライドのような C_6-C_{10} アリールスルホニルハライド、メタンスルホン酸無水物、エタンスルホン酸無水物のような C_1-C_4 アルカンスルホン酸無水物、ベンゼンスルホン酸無水物、トルエンスルホン酸無水物のような C_6-C_{10} アリールスルホン酸無水物等、好適には、メタンスルホニルクロライド、ベンゼンスルホニルクロライド、p-トルエンスルホニルクロライド又はp-トルエンスルホン酸無水物)を用いて、前記A法第A2工程反応(b)のアシル化反応と同様に行なわれる。

【0111】第E5工程は、一般式(XXV)を有する化合物を製造する工程で、不活性溶剤中(例えば、ベンゼン、トルエン、キシレンのような芳香族炭化水素類、エーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサンのようなエーテル類、アセトニトリルのようなニトリル類、N、N-ジメチルアセトアミド、N-メチルピロリドン、ヘキサメチルホスホルアミドのようなアミド類、好適には、アミド類)、化合物(XXIV)をシアノ化合物(例えば、リチウムシアナイド、ナトリウムシアナイド、カリウムシアナイドのようなアルカリ金属シアナイド、好適には、ナトリウムシアナイド)と、 0°C 乃至 200°C (好適には、 20°C 乃至 100°C)で、30分間乃至48時間

(好適には、1乃至24時間)反応させることにより行われる。

【0112】第E6工程は、一般式(XXVI)を有する化合物を製造する工程で、酸の存在下(例えば、塩酸、硫酸、硝酸のような鉱酸、酢酸、トリフルオロ酢酸のような脂肪酸、メタンスルホン酸、トリフルオロメタンスルホン酸、ベンゼンスルホン酸、p-トルエンスルホン酸のようなスルホン酸、好適には、化合物(XXIV)を大過剰の C_1-C_6 アルコール(好適には、メタノール又はエタノール)と、 0°C 乃至 200°C (好適には、 20°C 乃至 100°C)で、10分間乃至48時間(好適には、30分間乃至14時間)反応させることにより行われる。

【0113】第E7工程は、一般式(XXVII)を有する化合物を製造する工程で、化合物(XXVI)を還元剤と反応させることにより達成され、本工程は、前記D法第D1工程と同様に行われる。

【0114】第E8工程は、化合物(IIIa)を製造する工程で、化合物(XXVII)をハロゲン化することにより達成され、本工程は、前記D法第D2工程と同様に行われる。

【0115】反応終了後、各工程の目的化合物は、常法に従って、反応混合物から採取される。例えば、反応混合物を適宜中和し、又、不溶物が存在する場合は、適宜濾去して、溶剤を減圧留去することによって又は溶剤を減圧留去した後、残留物に水を加え、酢酸エチルのような水不混和性有機溶媒で抽出し、無水硫酸マグネシウム等で乾燥後、溶媒を留去することにより得ることができ、必要ならば、常法、例えば、再結晶、カラムクロマトグラフィー等でさらに精製することができる。化合物(1)は、アドレナリン α_1 拮抗作用をほとんど有さず、セロトニン2受容体拮抗作用及びスクアレンシンターゼ阻害活性を併せ持ち、それらの作用が持続的であり、毒性が弱いため、(1)血管内皮細胞や血小板に分布するセロトニン2受容体を遮断し、血小板凝集阻害に基づく血栓性疾患の治療剤もしくは予防剤(好適には、治療剤)またはこれらの疾患に起因する各種疾病、例えば、冠動脈疾患、脳血管障害等の治療剤もしくは予防剤(好適には、治療剤)として有用であり、(2)コレステロール低下作用に基づく高脂血症及び動脈硬化性疾患の治療剤または予防剤として有用であり、(3)更にセロトニン2受容体拮抗作用とコレステロール低下作用を併せ持つことにより、すぐれた動脈硬化性疾患治療剤または予防剤(好適には、治療剤)として有用である。

【0116】本発明の化合物(1)およびその薬理上許容される塩類を上記疾患の治療剤または予防剤として使用する場合には、それ自体あるいは適宜の薬理学的に許容される、賦形剤、希釈剤等と混合し、錠剤、カプセル剤、顆粒剤、散剤若しくはシロップ剤等による経口的又は注射剤等による非経口的に投与することができる。これらの製剤は、賦形剤(例えば、乳糖、白糖、ブドウ糖、マンニット、ソルビットのような糖誘導体；トウモロコシデンプン、馬鈴薯デンプン、 α -デンプン、デキ

ストリン、カルボキシメチルデンプンのようなデンプン誘導体；結晶セルロース、低置換度ヒドロキシプロピルセルロース、ヒドロキシプロピルメチルセルロース、カルボキシメチルセルロース、カルボキシメチルセルロースカルシウム、内部架橋カルボキシメチルセルロースナトリウムのようなセルロース誘導体；アラビアゴム；デキストラン；プルラン；軽質無水珪酸、合成珪酸アルミニウム、メタ珪酸アルミニウム酸マグネシウムのような珪酸塩誘導体；リン酸カルシウムのようなリン酸塩誘導体；炭酸カルシウムのような炭酸塩誘導体；硫酸カルシウムのような硫酸塩誘導体等）、結合剤（例えば、前記の賦形剤；ゼラチン；ポリビニルピロリドン；マクロゴール等）、崩壊剤（例えば、前記の賦形剤；クロスカルメロースナトリウム、カルボキシメチルスターチナトリウム、架橋ポリビニルピロリドンのような化学修飾された、デンプン、セルロース誘導体等）、滑沢剤（例えば、タルク；ステアリン酸；ステアリン酸カルシウム、ステアリン酸マグネシウムのようなステアリン酸金属塩；コロイドシリカ；ビーガム、ゲイロウのようなラックス類；硼酸；グリコール；フマル酸、アジピン酸のようなカルボン酸類；安息香酸ナトリウムのようなカルボン酸ナトリウム塩；硫酸ナトリウムのような硫酸類塩；ロイシン；ラウリル硫酸ナトリウム、ラウリル硫酸マグネシウムのようなラウリル硫酸塩；無水珪酸、珪酸水和物のような珪酸類；前記の賦形剤におけるデンプン誘導体等）、安定剤（例えば、メチルパラベン、プロピルパラベンのようなパラオキシ安息香酸エステル類；クロロブタノール、ベンジルアルコール、フェニルエチルアルコールのようなアルコール類；塩化ベンザルコニウム；フェノール、クレゾールのようなフェノール類；チメロサル；無水酢酸；ソルビン酸等）、矯味矯臭剤（例えば、通常使用される、甘味料、酸味料、香料等）、希釈剤、注射剤用溶剤（例えば、水、エタノール、グリセリン等）等の添加剤を用いて周知の方法で製造される。その使用量は症状、年齢等により異なるが、経口投与の場合には、1回当たり1日下限1mg（好適には、10mg）、上限2000mg（好適には、400mg）を、静脈内投与の場合には、1回当たり1日下限0.1mg（好適には、1mg）、上限500mg（好適には、300mg）を成人に対して、1日当たり1乃至6回症状に応じて投与することが望ましい。以下に、実施例、参考例、試験例及び製剤例を示し、本発明をさらに詳細に説明するが、本発明の範囲は、これらに限定されるものではない。

【0117】

【実施例】

実施例1

1-メチル-2-[2-[4-フェニル-2-(2-フェニルエチル)フェノキシ]エチル]ピロリジン塩酸塩
(a) 1-メチル-2-[2-[4-フェニル-2-

(2-フェニルエチル)フェノキシ]エチル]ピロリジン

4-フェニル-2-(2-フェニルエチル)フェノール 260mgをN,N-ジメチルアセトアミド5mlに溶解し、氷冷攪拌下にカリウムt-ブトキシド240mgを加えた。これに2-(2-クロロエチル)-1-メチルピロリジン塩酸塩180mgを加え、室温で17時間攪拌し、さらに50℃で2時間攪拌した。反応液に氷水と酢酸エチルを加えて分液し、酢酸エチル層を分離し、食塩水で洗浄し、無水硫酸ナトリウムで脱水乾燥し、減圧濃縮して、油状物を得た。これをシリカゲルカラムクロマトグラフィー（溶出溶剤：塩化メチレン/メタノール=19/1）で精製して、標記化合物220mg（収率60%）を無色油状物として得た。

NMRスペクトル(270MHz, CDCl₃) δ ppm: 1.55-1.95 (4H, m)、1.95-2.15 (1H, m)、2.15-2.5 (3H, m)、2.42 (3H, s)、2.8-3.05 (4H, m)、3.1-3.25 (1H, m)、3.95-4.2 (2H, m)、6.92 (1H, d, J=8.4Hz)、7.15-7.6 (12H, m)。

(b) 1-メチル-2-[2-[4-フェニル-2-(2-フェニルエチル)フェノキシ]エチル]ピロリジン塩酸塩

前記(a)工程で得た1-メチル-2-[2-[4-フェニル-2-(2-フェニルエチル)フェノキシ]エチル]ピロリジン220mgを酢酸エチル5mlに溶解し、4規定塩化水素-酢酸エチル溶液0.15mlを加え、析出した結晶をろ取り、少量の酢酸エチルで洗浄し、真空中で乾燥して、標記化合物195mg（収率80%）を無色結晶として得た。

融点: 153-155℃。

NMRスペクトル(270MHz, CDCl₃) δ ppm: 1.9-2.2 (2H, m)、2.15-2.4 (2H, m)、2.4-2.7 (2H, m)、2.76 (3H, s)、2.7-3.1 (5H, m)、3.2-3.4 (1H, m)、3.8-3.95 (1H, m)、3.95-4.1 (1H, m)、4.2-4.35 (1H, m)、6.92 (1H, d, J=8.4Hz)、7.1-7.6 (12H, m)。

【0118】実施例2

(2R, 4R)-4-ヒドロキシ-1-メチル-2-[2-[4-フェニル-2-(2-フェニルエチル)フェノキシ]エチル]ピロリジン

(a) (2R, 4R)-4-ジメチルカルバモイルオキシ-1-オクチルオキシカルボニル-2-[2-[4-フェニル-2-(2-フェニルエチル)フェノキシ]エチル]ピロリジン

4-フェニル-2-(2-フェニルエチル)フェノール 290mgをN,N-ジメチルアセトアミド5mlに溶

解し、氷冷攪拌下にカリウム *t*-ブトキシド130mgを加え、次いで、(2S, 4R)-2-(2-プロモエチル)-4-ジメチルカルバモイルオキシ-1-オクチルオキシカルボニルピロリジン480mgを加え、室温で1時間攪拌し、さらに50℃で3時間攪拌した。実施例1(a)工程と同様に後処理して、シリカゲルカラムクロマトグラフィー(溶出溶剤:塩化メチレン/メタノール=19/1)で精製して、標記化合物641mg(収率99%)を無色油脂状物として得た。

NMRスペクトル(270MHz, CDCl₃) δ ppm: 0.75-0.95 (3H, m)、1.1-1.45 (10H, m)、1.45-1.75 (2H, m)、1.8-2.15 (2H, m)、2.2-2.7 (2H, m)、2.7-3.1 (4H, m)、2.77 (3H, s)、2.88 (3H, s)、3.55 (1H, dd, J=4.4および12.6Hz)、3.55-3.95 (1H, m)、3.95-4.35 (5H, m)、5.1-5.25 (1H, m)、6.90 (1H, d, J=8.2Hz)、7.1-7.55 (12H, m)。

(b) (2R, 4R)-4-ヒドロキシー-1-メチル-2-[2-[4-フェニル-2-(2-フェニルエチル)フェノキシ]エチル]ピロリジン

水素化アルミニウムリチウム135mgをテトラヒドロフラン2mlに加え、氷冷攪拌下に前記(a)工程で得た(2R, 4R)-4-ジメチルカルバモイルオキシ-1-オクチルオキシカルボニル-2-[2-[4-フェニル-2-(2-フェニルエチル)フェノキシ]エチル]ピロリジン641mgのテトラヒドロフラン5ml溶液を滴下し、同温で1時間攪拌した。反応溶液に硫酸ナトリウム10水和物を少しずつガスの発生がなくなるまで加え、さらに30分攪拌して過剰の水素化物を分解した。不溶物をろ去し、ろ液を減圧濃縮して、油状物を得た。これをシリカゲルカラムクロマトグラフィー(溶出溶剤:塩化メチレン/メタノール=9/1)で精製して、320mg(収率67%)の無色油状物を得た。この内の220mgにヘキサンを加えて、かき混ぜ、析出した結晶をろ取し、真空で乾燥して、標記化合物175mg(結晶化収率80%)を無色結晶として得た。

融点: 95-97℃。

NMRスペクトル(270MHz, CDCl₃) δ ppm: 1.7-1.9 (1H, m)、1.9-2.1 (2H, m)、2.2-2.45 (1H, m)、2.29 (1H, dd, J=4.9および10.4Hz)、2.44 (3H, s)、2.75-3.1 (5H, m)、3.54 (1H, dd, J=6.2および10.4Hz)、3.95-4.2 (2H, m)、4.35-4.55 (1H, m)、6.91 (1H, d, J=8.5Hz)、7.15-7.6 (12H, m)。

【0119】実施例3

N, N-ジメチル-3-[4-フェニル-2-(2-フ

エニルエチル)フェノキシ]プロピルアミン塩酸塩
(a) N, N-ジメチル-3-[4-フェニル-2-(2-フェニルエチル)フェノキシ]プロピルアミン3-プロモプロピル [4-フェニル-2-(2-フェニルエチル)フェニル] エーテル190mgをテトラヒドロフラン4mlに溶解し50%ジメチルアミン水溶液1mlを加え、50℃で4時間攪拌した。反応液にエーテルと水を加えて分液し、エーテル層を更に食塩水で洗浄し、無水硫酸ナトリウムで脱水し、減圧濃縮した。これをシリカゲルカラムクロマトグラフィー(溶出溶剤:塩化メチレン/メタノール=9/1)で精製して、標記化合物120mg(収率69%)を無色固体として得た。

NMRスペクトル(270MHz, CDCl₃) δ ppm: 1.95-2.1 (2H, m)、2.28 (6H, s)、2.53 (2H, t, J=7.3Hz)、2.85-3.05 (4H, m)、4.08 (2H, t, J=6.2Hz)、6.93 (1H, d, J=8.3Hz)、7.15-7.55 (12H, m)。

(b) N, N-ジメチル-3-[4-フェニル-2-(2-フェニルエチル)フェノキシ]プロピルアミン塩酸塩

前記(a)工程で得たN, N-ジメチル-3-[4-フェニル-2-(2-フェニルエチル)フェノキシ]プロピルアミン120mgを酢酸エチル2mlに溶解し、4規定塩化水素-酢酸エチル溶液0.09mlを加えた。析出した結晶をろ取し、少量の酢酸エチルで洗浄し、真空で乾燥して、標記化合物113mg(収率85%)を無色結晶として得た。

融点: 157-159℃。

NMRスペクトル(270MHz, CDCl₃) δ ppm: 2.3-2.5 (2H, m)、2.79 (6H, s)、2.8-3.05 (4H, m)、3.1-3.25 (2H, m)、4.11 (2H, t, J=5.5Hz)、6.90 (1H, d, J=8.5Hz)、7.15-7.6 (12H, m)。

【0120】実施例4

N-イソプロピル-3-[4-フェニル-2-(2-フェニルエチル)フェノキシ]プロピルアミン塩酸塩

(a) N-イソプロピル-3-[4-フェニル-2-(2-フェニルエチル)フェノキシ]プロピルアミン3-プロモプロピル [4-フェニル-2-(2-フェニルエチル)フェニル] エーテル190mgをテトラヒドロフラン4mlに溶解し、イソプロピルアミン1.2mlを加え、20時間加熱還流した。実施例3と同様に後処理して、シリカゲルカラムクロマトグラフィー(溶出溶剤:塩化メチレン/メタノール=19/1)で精製して、標記化合物120mg(収率66%)を無色固体として得た。

NMRスペクトル(270MHz, CDCl₃) δ ppm: 1.07

(6H, d, $J=6.0\text{ Hz}$)、1.95–2.1 (2H, m)、2.75–3.1 (7H, m)、4.10 (2H, t, $J=6.0\text{ Hz}$)、6.93 (1H, d, $J=8.4\text{ Hz}$)、7.15–7.6 (12H, m)。

(b) N-イソプロピル-3-[4-フェニル-2-(2-フェニルエチル)フェノキシ]プロピルアミン塩酸塩

前記(a)工程で得たN-イソプロピル-3-[4-フェニル-2-(2-フェニルエチル)フェノキシ]プロピルアミン120mgを酢酸エチル2mlに溶解し、4規定塩化水素-酢酸エチル溶液0.08mlを加えた。析出した結晶をろ取し、少量の酢酸エチルで洗浄し、真空中で乾燥して、標記化合物122mg(収率92%)を無色結晶として得た。

融点: 172–174℃。

NMRスペクトル(270MHz, CDCl_3) δ ppm: 1.46 (6H, d, $J=6.5\text{ Hz}$)、2.4–2.6 (2H, m)、2.8–3.05 (4H, m)、3.16 (2H, t, $J=7.8\text{ Hz}$)、3.2–3.4 (1H, m)、4.09 (2H, t, $J=5.8\text{ Hz}$)、6.87 (1H, d, $J=8.5\text{ Hz}$)、7.1–7.55 (12H, m)。

【0121】実施例5

1-メチル-2-[2-[5-フェニル-2-(2-フェニルエチル)フェノキシ]エチル]ピロリジン塩酸塩
(a) 1-メチル-2-[2-[5-フェニル-2-(2-フェニルエチル)フェノキシ]エチル]ピロリジン

5-フェニル-2-(2-フェニルエチル)フェノール300mgをN,N-ジメチルアセトアミ15mlに溶解し、氷冷撹拌下にカリウムt-ブトキシド260mgを加え、更に、2-(2-クロロエチル)-1-メチルピロリジン塩酸塩220mgを加え、室温として2時間撹拌し、さらに50℃に加温して2時間撹拌した。反応液に氷水と酢酸エチルを加えて分液し、酢酸エチル層を分離し、食塩水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで脱水乾燥し、減圧濃縮して、油状物を得た。これを実施例1

(a)工程と同様に分液し、シリカゲルカラムクロマトグラフィー(溶出溶剤: 塩化メチレン/メタノール=19/1)で精製して、標記化合物220mg(収率52%)を無色油状物として得た。

NMRスペクトル(270MHz, CDCl_3) δ ppm: 1.55–2.5 (8H, m)、2.41 (3H, s)、2.8–3.05 (4H, m)、3.16 (1H, t, $J=7.5\text{ Hz}$)、4.0–4.25 (2H, m)、7.07 (1H, s)、7.1–7.4 (8H, m)、7.44 (2H, t, $J=7.5\text{ Hz}$)、7.58 (2H, d, $J=6.9\text{ Hz}$)。

(b) 1-メチル-2-[2-[5-フェニル-2-(2-フェニルエチル)フェノキシ]エチル]ピロリジ

ン塩酸塩

前記(a)工程で得た1-メチル-2-[2-[5-フェニル-2-(2-フェニルエチル)フェノキシ]エチル]ピロリジン220mgを酢酸エチル4mlに溶解し、4規定塩化水素-酢酸エチル溶液0.15mlを加えた。これに少量のヘキサンを加えて静置し、析出した結晶をろ取し、少量の混合溶媒(ヘキサン/酢酸エチル=1/4)で洗浄し、真空中で乾燥して、標記化合物226mg(収率93%)を無色結晶として得た。

融点: 123–125℃。

NMRスペクトル(270MHz, CDCl_3) δ ppm: 1.85–2.2 (2H, m)、2.2–2.4 (2H, m)、2.4–2.7 (2H, m)、2.77 (3H, s)、2.7–3.05 (5H, m)、3.2–3.4 (1H, m)、3.8–4.0 (1H, m)、4.0–4.15 (1H, m)、4.2–4.4 (1H, m)、7.04 (1H, s)、7.1–7.4 (8H, m)、7.45 (2H, t, $J=7.3\text{ Hz}$)、7.58 (2H, d, $J=7.1\text{ Hz}$)。

【0122】実施例6

(2R, 4R)-4-ヒドロキシ-1-メチル-2-[2-[5-フェニル-2-(2-フェニルエチル)フェノキシ]エチル]ピロリジン

(a) (2R, 4R)-4-ジメチルカルバモイルオキシ-1-オクチルオキシカルボニル-2-[2-[5-フェニル-2-(2-フェニルエチル)フェノキシ]エチル]ピロリジン

5-フェニル-2-(2-フェニルエチル)フェノール250mgをN,N-ジメチルアセトアミ5mlに溶解し、氷冷撹拌下にカリウムt-ブトキシド110mgを加え、次いで、(2S, 4R)-2-(2-プロモエチル)-4-ジメチルカルバモイルオキシ-1-オクチルオキシカルボニルピロリジン430mgを加え、室温で2時間撹拌し、さらに50℃で4時間撹拌した。実施例1(a)工程と同様に後処理し、シリカゲルカラムクロマトグラフィー(溶出溶剤: 塩化メチレン/メタノール=19/1)で精製して、標記化合物510mg(収率91%)を無色油状物として得た。

NMRスペクトル(270MHz, CDCl_3) δ ppm: 0.75–0.95 (3H, m)、1.1–1.45 (10H, m)、1.45–1.75 (2H, m)、1.8–2.15 (2H, m)、2.2–2.8 (2H, m)、2.77 (3H, s)、2.8–3.1 (4H, m)、2.87 (3H, s)、3.5–3.95 (1H, m)、3.54 (1H, dd, $J=4.4$ および12.6Hz)、3.95–4.35 (5H, m)、5.1–5.3 (1H, m)、7.0–7.4 (9H, m)、7.43 (2H, t, $J=7.5\text{ Hz}$)、7.58 (2H, d, $J=7.3\text{ Hz}$)。

(b) (2R, 4R)-4-ヒドロキシ-1-メチル-

2-[2-[5-フェニル-2-(2-フェニルエチル)フェノキシ]エチル]ピロリジン

水素化アルミニウムリチウム94mgをテトラヒドロフラン2mlに加え、室温攪拌下に前記(a)工程で得た(2R, 4R)-4-ジメチルカルバモイルオキシ-1-オクチルオキシカルボニル-2-[2-[5-フェニル-2-(2-フェニルエチル)フェノキシ]エチル]ピロリジン510mgのテトラヒドロフラン5ml溶液を滴下し、室温で1時間攪拌した。反応液を氷冷し、硫酸ナトリウム10水和物を少しずつガスの発生がなくなるまで加え、30分攪拌して過剰の水素化物を分解した。不溶物をろ去し、ろ液を減圧濃縮して、油状物を得た。シリカゲルカラムクロマトグラフィー(溶出溶剤:塩化メチレン/メタノール=19/1)で精製して、標記化合物200mg(収率60%)の無色固体を得た。

融点: 113-115℃。

NMRスペクトル(270MHz, CDCl₃) δ ppm: 1.65-1.85(1H, m)、1.85-2.05(2H, m)、2.15-2.4(1H, m)、2.23(1H, dd, J=5.1および10.2Hz)、2.40(3H, s)、2.65-2.8(1H, m)、2.85-3.05(4H, m)、3.49(1H, dd, J=6.2および10.2Hz)、4.0-4.2(2H, m)、4.35-4.5(1H, m)、7.06(1H, s)、7.1-7.4(8H, m)、7.44(2H, t, J=7.4Hz)、7.58(2H, d, J=7.2Hz)。

【0123】実施例7

N, N-ジメチル-3-[5-フェニル-2-(2-フェニルエチル)フェノキシ]プロピルアミン塩酸塩

(a) N, N-ジメチル-3-[5-フェニル-2-(2-フェニルエチル)フェノキシ]プロピルアミン3-ブロモプロピル[5-フェニル-2-(2-フェニルエチル)フェニル]エーテル300mgをテトラヒドロフラン5mlに溶解し、50%ジメチルアミン水溶液1.5mlを加え、50℃で2時間攪拌した。実施例3(a)工程と同様に後処理し、シリカゲルカラムクロマトグラフィー(溶出溶剤:塩化メチレン/メタノール=19/1)で精製して、標記化合物170mg(収率62%)を無色固体として得た。

NMRスペクトル(270MHz, CDCl₃) δ ppm: 1.95-2.1(2H, m)、2.28(6H, s)、2.53(2H, t, J=7.3Hz)、2.8-3.05(4H, m)、4.11(2H, t, J=6.2Hz)、7.08(1H, s)、7.05-7.4(8H, m)、7.43(2H, t, J=7.4Hz)、7.58(2H, d, J=7.4Hz)。

(b) N, N-ジメチル-3-[5-フェニル-2-(2-フェニルエチル)フェノキシ]プロピルアミン塩酸塩

前記(a)工程で得たN, N-ジメチル-3-[5-フェニル-2-(2-フェニルエチル)フェノキシ]プロピルアミン170mgを酢酸エチル2mlに溶解し、4規定塩化水素-酢酸エチル溶液0.11mlを加えた。析出した結晶をろ取し、酢酸エチルで洗浄し、真空で乾燥して、標記化合物180mg(収率96%)を無色結晶とし得た。

融点: 138-140℃。

NMRスペクトル(270MHz, CDCl₃) δ ppm: 2.35-2.5(2H, m)、2.78(6H, s)、2.8-3.05(4H, m)、3.1-3.25(2H, m)、4.14(2H, t, J=5.5Hz)、7.02(1H, s)、7.1-7.4(8H, m)、7.45(2H, t, J=7.4Hz)、7.57(2H, d, J=6.9Hz)。

【0124】実施例8

1-メチル-2-[2-[4-フェノキシ-2-(2-フェニルエチル)フェノキシ]エチル]ピロリジン塩酸塩

(a) 1-メチル-2-[2-[4-フェノキシ-2-(2-フェニルエチル)フェノキシ]エチル]ピロリジン

4-フェノキシ-2-(2-フェニルエチル)フェノール500mgをN, N-ジメチルアセトアミド10mlに溶解し、氷冷攪拌下にカリウムt-ブトキシド412mgを加え、次いで、2-(2-クロロエチル)-1-メチルピロリジン塩酸塩412mgを加えて、室温で14時間攪拌し、さらに50℃で4時間攪拌した。反応液を実施例1と同様に後処理し、シリカゲルカラムクロマトグラフィー(溶出溶剤:塩化メチレン/メタノール=10/1)で精製して、標記化合物239mg(収率35%)を油状物として得た。

NMRスペクトル(270MHz, CDCl₃) δ ppm: 1.55-1.95(4H, m)、1.95-2.15(1H, m)、2.15-2.35(2H, m)、2.35-2.55(1H, m)、2.42(3H, s)、2.8-3.0(4H, m)、3.1-3.3(1H, m)、3.9-4.15(2H, m)、6.75-6.95(5H, m)、7.03(1H, t, J=7.5Hz)、7.1-7.35(7H, m)。

(b) 1-メチル-2-[2-[4-フェノキシ-2-(2-フェニルエチル)フェノキシ]エチル]ピロリジン塩酸塩

前記(a)工程で得た1-メチル-2-[2-[4-フェノキシ-2-(2-フェニルエチル)フェノキシ]エチル]ピロリジン225mgを酢酸エチル4mlに溶解し、4規定塩化水素-酢酸エチル溶液0.21mlを加えた。減圧濃縮し、少量の塩化メチレンに溶解し、酢酸エチルを加えた。析出した結晶をろ取し、少量の酢酸エチルで洗浄し、真空で乾燥して、標記化合物145mg

(収率59%)を無色結晶として得た。

融点: 120-123℃。

NMRスペクトル(270MHz, CDCl₃) δ ppm: 1.9-2.15 (2H, m)、2.15-2.4 (2H, m)、2.4-2.6 (2H, m)、2.76 (3H, s)、2.7-3.0 (5H, m)、3.15-3.4 (1H, m)、3.8-4.05 (2H, m)、4.1-4.25 (1H, m)、6.75-6.95 (5H, m)、7.05 (1H, t, J=7.6 Hz)、7.1-7.4 (7H, m)。

【0125】実施例9

N, N-ジメチル-3-[4-フェノキシ-2-(2-フェニルエチル)フェノキシ]プロピルアミン塩酸塩

(a) N, N-ジメチル-3-[4-フェノキシ-2-(2-フェニルエチル)フェノキシ]プロピルアミン3-ブロモプロピル [4-フェノキシ-2-(2-フェニルエチル)フェニル] エーテル260mgをテトラヒドロフラン4mlに溶解し、50%ジメチルアミン水溶液0.33mlを加えて、40℃で3時間攪拌した。さらに50%ジメチルアミン水溶液0.33mlを追加し、40℃で5時間攪拌した。減圧濃縮し、シリカゲルカラムクロマトグラフィー(溶出溶剤: 塩化メチレン/メタノール=10/1)で精製して、標記化合物209mg (収率89%)を無色固体として得た。

NMRスペクトル(270MHz, CDCl₃) δ ppm: 2.35-2.5 (2H, m)、2.79 (6H, s)、2.87 (4H, s)、3.1-3.25 (2H, m)、4.04 (2H, t, J=5.6 Hz)、6.75-6.95 (5H, m)、7.0-7.35 (8H, m)。

(b) N, N-ジメチル-3-[4-フェノキシ-2-(2-フェニルエチル)フェノキシ]プロピルアミン塩酸塩

前記(a)工程で得たN, N-ジメチル-3-[4-フェノキシ-2-(2-フェニルエチル)フェノキシ]プロピルアミン204mgをジオキサン4mlに溶解し、4規定塩化水素-ジオキサン溶液0.20mlを加えた。減圧濃縮し、少量の塩化メチレンに溶解し、酢酸エチルを加えた。析出した結晶をろ取し、少量の酢酸エチルで洗浄し、真空で乾燥して、標記化合物143mg (収率64%)を無色結晶とし得た。

融点: 139-141℃。

NMRスペクトル(270MHz, CDCl₃) δ ppm: 2.35-2.5 (2H, m)、2.80 (6H, s)、2.87 (4H, s)、3.15-3.25 (2H, m)、4.05 (2H, t, J=5.6 Hz)、6.75-6.95 (5H, m)、7.05 (1H, t, J=7.3 Hz)、7.1-7.35 (7H, m)。

【0126】実施例10

2-[2-[4-ブトキシ-2-(2-フェニルエチル)フェノキシ]エチル]-1-メチルピロリジン塩酸塩

塩

(a) 2-[2-[4-ブトキシ-2-(2-フェニルエチル)フェノキシ]エチル]-1-メチルピロリジン4-ブトキシ-2-(2-フェニルエチル)フェノール500mgをN, N-ジメチルアセタミド5mlに溶解し、氷冷攪拌下にカリウムt-ブトキシド310mgを加え、次いで、2-(2-クロロエチル)-1-メチルピロリジン塩酸塩510mgを加え、50℃で7時間攪拌した。実施例1と同様に後処理し、シリカゲルカラムクロマトグラフィー(溶出溶剤: 塩化メチレン/メタノール=10/1)で精製して、標記化合物390mg (収率55%)を固体として得た。

NMRスペクトル(270MHz, CDCl₃) δ ppm: 0.97 (3H, t, J=7.3 Hz)、1.4-1.6 (2H, m)、1.6-2.0 (6H, m)、2.0-2.2 (1H, m)、2.2-2.45 (2H, m)、2.49 (3H, s)、2.5-2.7 (1H, m)、2.87 (4H, s)、3.25-3.4 (1H, m)、3.85-4.0 (1H, m)、3.88 (2H, t, J=6.6 Hz)、4.0-4.1 (1H, m)、6.65-6.8 (3H, m)、7.15-7.35 (5H, m)。

(b) 2-[2-[4-ブトキシ-2-(2-フェニルエチル)フェノキシ]エチル]-1-メチルピロリジン塩酸塩

前記(a)工程で得た2-[2-[4-ブトキシ-2-(2-フェニルエチル)フェノキシ]エチル]-1-メチルピロリジン390mgを酢酸エチル4mlに溶解し、4規定塩化水素-酢酸エチル溶液0.39mlを加えた。減圧で濃縮し、酢酸エチルに溶解し、静置した。析出した結晶をろ取し、少量の酢酸エチルで洗浄し、真空で乾燥して、標記化合物380mg (収率89%)を無色結晶とし得た。

融点: 111-112℃。

NMRスペクトル(270MHz, CDCl₃) δ ppm: 0.97 (3H, t, J=7.3 Hz)、1.4-1.6 (2H, m)、1.65-1.8 (2H, m)、1.85-2.15 (2H, m)、2.15-2.35 (2H, m)、2.35-2.6 (2H, m)、2.6-2.95 (5H, m)、2.74 (3H, s)、3.15-3.5 (1H, m)、3.8-4.0 (2H, m)、3.89 (2H, t, J=6.5 Hz)、4.1-4.2 (1H, m)、6.65-6.8 (3H, m)、7.1-7.35 (5H, m)。

【0127】実施例11

1-メチル-2-[2-[4-オクチルオキシ-2-(2-フェニルエチル)フェノキシ]エチル]ピロリジン塩酸塩

(a) 1-メチル-2-[2-[4-オクチルオキシ-2-(2-フェニルエチル)フェノキシ]エチル]ピロ

リジン

2-[2-[4-ヒドロキシ-2-(2-フェニルエチル)フェノキシ]エチル]-1-メチルピロリジン110mgをN,N-ジメチルアセタミド4mlに溶解し、氷冷攪拌下にカリウムt-ブトキシド75mgを加え、次いで、ヨードオクタン0.08mlを加え、室温で8時間攪拌した。これを実施例1と同様に後処理し、シリカゲルカラムクロマトグラフィー(溶出溶剤:塩化メチレン/メタノール=5/1)で精製して、標記化合物65mg(収率49%)を無色油状物として得た。

NMRスペクトル(270MHz, CDCl₃) δ ppm: 0.89 (3H, t, J=5.9Hz)、1.2-1.5 (10H, m)、1.5-1.9 (6H, m)、1.9-2.1 (1H, m)、2.1-2.45 (3H, m)、2.37 (3H, s)、2.87 (4H, s)、3.05-3.2 (1H, m)、3.85-4.1 (2H, m)、3.87 (2H, t, J=6.6Hz)、6.6-6.8 (3H, m)、7.1-7.35 (5H, m)。

(b) 1-メチル-2-[2-[4-オクチルオキシ-2-(2-フェニルエチル)フェノキシ]エチル]ピロリジン塩酸塩

前記(a)工程で得た1-メチル-2-[2-[4-オクチルオキシ-2-(2-フェニルエチル)フェノキシ]エチル]ピロリジン62mgを酢酸エチル3mlに溶解し、4規定塩化水素-酢酸エチル溶液0.05mlを加えた。減圧で濃縮し、無色固体を得た。これをエーテル中で粉碎し、ろ取り、エーテル10mlで洗浄し、真空中で乾燥して、標記化合物65mg(収率97%)を無色結晶とし得た。

融点: 102-104℃。

NMRスペクトル(270MHz, CDCl₃) δ ppm: 0.89 (3H, t, J=5.8Hz)、1.2-1.55 (10H, m)、1.65-1.85 (2H, m)、1.9-2.15 (2H, m)、2.15-2.35 (2H, m)、2.35-2.6 (2H, m)、2.65-3.0 (5H, m)、2.74 (3H, s)、3.15-3.35 (1H, m)、3.75-4.0 (2H, m)、3.88 (2H, t, J=6.6Hz)、4.05-4.2 (1H, m)、6.65-6.85 (3H, m)、7.1-7.35 (5H, m)。

【0128】実施例12

N,N-ジメチル-3-[4-ブトキシ-2-(2-フェニルエチル)フェノキシ]プロピルアミン塩酸塩

(a) N,N-ジメチル-3-[4-ブトキシ-2-(2-フェニルエチル)フェノキシ]プロピルアミン3-ブロモプロピル [4-ブトキシ-2-(2-フェニルエチル)フェニル] エーテル850mgをテトラヒドロフラン5mlに溶解し、50%ジメチルアミン水溶液2.28mlを加え、40℃で7時間攪拌した。これを減圧濃縮し、シリカゲルカラムクロマトグラフィー

(溶出溶剤:塩化メチレン/メタノール=10/1)で精製して、標記化合物750mg(収率97%)を無色固体として得た。

NMRスペクトル(270MHz, CDCl₃) δ ppm: 0.97 (3H, t, J=7.3Hz)、1.35-1.6 (2H, m)、1.65-1.85 (2H, m)、2.15-2.35 (2H, m)、2.64 (6H, s)、2.86 (4H, s)、2.9-3.1 (2H, m)、3.88 (2H, t, J=6.5Hz)、3.98 (2H, t, J=5.7Hz)、6.6-6.85 (3H, m)、7.1-7.4 (5H, m)。

(b) N,N-ジメチル-3-[4-ブトキシ-2-(2-フェニルエチル)フェノキシ]プロピルアミン塩酸塩

前記(a)工程で得たN,N-ジメチル-3-[4-ブトキシ-2-(2-フェニルエチル)フェノキシ]プロピルアミン750mgをジオキサン4mlに溶解し、4規定塩化水素-ジオキサン溶液0.80mlを加えた。減圧で濃縮し、少量の塩化メチレンに溶解し、酢酸エチルを加えた。析出した結晶をろ取り、少量の酢酸エチルで洗浄し、真空中で乾燥して、標記化合物510mg(収率62%)を無色結晶とし得た。

融点: 121-122℃。

NMRスペクトル(270MHz, CDCl₃) δ ppm: 0.97 (3H, t, J=7.3Hz)、1.35-1.6 (2H, m)、1.65-1.85 (2H, m)、2.25-2.45 (2H, m)、2.77 (6H, s)、2.86 (4H, s)、3.05-3.2 (2H, m)、3.88 (2H, t, J=6.4Hz)、3.98 (2H, t, J=5.6Hz)、6.4-6.8 (3H, m)、7.1-7.35 (5H, m)。

【0129】実施例13

N,N-ジメチル-3-[4-オクチルオキシ-2-(2-フェニルエチル)フェノキシ]プロピルアミン塩酸塩

(a) N,N-ジメチル-3-[4-オクチルオキシ-2-(2-フェニルエチル)フェノキシ]プロピルアミン

N,N-ジメチル-3-[4-ヒドロキシ-2-(2-フェニルエチル)フェノキシ]プロピルアミン212mgをN,N-ジメチルアセタミド5mlに溶解し、氷冷攪拌下にカリウムt-ブトキシド156mgを加え、次いで、ヨードオクタン0.17mlを加え、室温で4時間攪拌した。これを実施例1と同様に後処理し、シリカゲルカラムクロマトグラフィー(溶出溶剤:塩化メチレン/メタノール=10/1)で精製して、標記化合物135mg(収率52%)を無色ワックス状物として得た。

NMRスペクトル(270MHz, CDCl₃) δ ppm: 0.89 (3H, t, J=5.9Hz)、1.2-1.45 (10H, m)、1.65-1.8 (2H, m)、1.9-

2. 1 (2H, m)、2. 27 (6H, s)、2. 51 (2H, t, J=7. 5 Hz)、2. 87 (4H, s)、3. 86 (2H, t, J=6. 6 Hz)、3. 96 (2H, t, J=6. 2 Hz)、6. 6-6. 85 (3H, m)、7. 1-7. 35 (5H, m)。

(b) N, N-ジメチル-3-[4-オクチルオキシ-2-(2-フェニルエチル)フェノキシ]プロピルアミン塩酸塩

前記(a)工程で得たN, N-ジメチル-3-[4-オクチルオキシ-2-(2-フェニルエチル)フェノキシ]プロピルアミン130mgをジオキサン3mlに溶解し、4規定塩化水素-ジオキサン溶液0. 15mlを加えた。減圧で濃縮し、少量の塩化メチレンに溶解し、酢酸エチルを加えた。析出した結晶をろ取り、少量の酢酸エチルで洗浄し、減圧で乾燥して、標記化合物56mg(収率40%)を無色結晶とし得た。

融点: 122-124℃。

NMRスペクトル(270MHz, CDCl₃) δ ppm: 0. 89 (3H, t, J=6. 6 Hz)、1. 2-1. 55 (10H, m)、1. 65-1. 85 (2H, m)、2. 25-2. 45 (2H, m)、2. 76 (6H, s)、2. 86 (4H, s)、3. 05-3. 2 (2H, m)、3. 87 (2H, t, J=6. 6 Hz)、3. 98 (2H, t, J=5. 5 Hz)、6. 65-6. 8 (3H, m)、7. 1-7. 35 (5H, m)。

【0130】実施例14

N, N-ジメチル-3-[4-プロパルギルオキシ-2-(2-フェニルエチル)フェノキシ]プロピルアミン塩酸塩

(a) N, N-ジメチル-3-[4-プロパルギルオキシ-2-(2-フェニルエチル)フェノキシ]プロピルアミン

3-プロモプロピル [4-プロパルギルオキシ-2-(2-フェニルエチル)フェニル] エーテル112mgをテトラヒドロフラン3mlに溶解し、50%ジメチルアミン水溶液0. 15mlを加え、室温で22時間攪拌した。さらに50%ジメチルアミン水溶液0. 15mlを追加し、40℃で6時間攪拌した。減圧濃縮し、シリカゲルカラムクロマトグラフィー(溶出溶剤: 塩化メチレン/メタノール=5/1)で精製して、標記化合物113mg(収率99%)を無色固体として得た。

NMRスペクトル(270MHz, CDCl₃) δ ppm: 2. 3-2. 45 (2H, m)、2. 51 (1H, t, J=2. 1 Hz)、2. 77 (6H, s)、2. 87 (4H, s)、3. 1-3. 2 (2H, m)、4. 00 (2H, t, J=5. 6 Hz)、4. 62 (2H, d, J=2. 1 Hz)、6. 7-6. 85 (3H, m)、7. 1-7. 35 (5H, m)。

(b) N, N-ジメチル-3-[4-プロパルギルオキシ-2-(2-フェニルエチル)フェノキシ]プロピル

アミン塩酸塩

前記(a)工程で得たN, N-ジメチル-3-[4-プロパルギルオキシ-2-(2-フェニルエチル)フェノキシ]プロピルアミン109mgをジオキサン3mlに溶解し、4規定塩化水素-ジオキサン溶液0. 12mlを加えた。減圧で濃縮し、析出した固体を加熱溶解し、室温迄冷却した。析出した結晶をろ取り、少量のジオキサンで洗浄し、真空で乾燥して、標記化合物81mg(収率99%)を無色結晶とし得た。

融点: 165-168℃。

NMRスペクトル(270MHz, DMSO-d₆) δ ppm: 2. 0-2. 2 (2H, m)、2. 80 (6H, s)、2. 82 (4H, s)、3. 15-3. 3 (2H, m)、3. 52 (1H, t, J=2. 3 Hz)、3. 97 (2H, t, J=6. 0 Hz)、4. 69 (2H, d, J=2. 3 Hz)、6. 75-6. 95 (3H, m)、7. 1-7. 35 (5H, m)。

【0131】実施例15

1-メチル-2-[2-[3-(2-フェニルエチル)-2-ナフトキシ]エチル]ピロリジン塩酸塩

(a) 1-メチル-2-[2-[3-(2-フェニルエチル)-2-ナフトキシ]エチル]ピロリジン 3-(2-フェニルエチル)-2-ナフトール640mgをN, N-ジメチルアセトアミド10mlに溶解し、氷冷攪拌下にカリウムt-ブトキシド720mgを加え、次いで、2-(2-クロロエチル)-1-メチルピロリジン塩酸塩710mgを加え、室温で8時間攪拌した。反応液を実施例1と同様に後処理し、シリカゲルカラムクロマトグラフィー(溶出溶剤: 塩化メチレン/メタノール=10/1)で精製して、標記化合物480mg(収率52%)を油状物として得た。

NMRスペクトル(270MHz, CDCl₃) δ ppm: 1. 55-1. 95 (4H, m)、1. 95-2. 5 (4H, m)、2. 40 (3H, s)、2. 9-3. 2 (5H, m)、4. 05-4. 3 (2H, m)、7. 11 (1H, s)、7. 1-7. 45 (7H, m)、7. 55 (1H, s)、7. 65-7. 75 (2H, m)。

(b) 1-メチル-2-[2-[3-(2-フェニルエチル)-2-ナフトキシ]エチル]ピロリジン塩酸塩

前記(a)工程で得た1-メチル-2-[2-[3-(2-フェニルエチル)-2-ナフトキシ]エチル]ピロリジン480mgを酢酸エチル5mlに溶解し、4規定塩化水素-酢酸エチル溶液0. 5mlを加えた。減圧で濃縮し、無色固体を得た。これを酢酸エチルの溶解し、静置し、析出した結晶をろ取り、少量の酢酸エチルで洗浄し、真空で乾燥して、標記化合物461mg(収率87%)を得た。

融点: 158-161℃。

NMRスペクトル(270MHz, CDCl₃) δ ppm: 1. 9-2. 2 (2H, m)、2. 2-2. 45 (2H, m)、

2.45-2.85 (3H, m)、2.74 (3H, s)、2.85-3.15 (4H, m)、3.2-3.4 (1H, m)、3.8-4.0 (1H, m)、4.05-4.2 (1H, m)、4.25-4.45 (1H, m)、7.12 (1H, s)、7.1-7.5 (7H, m)、7.59 (1H, s)、7.65-7.8 (2H, m)。

【0132】実施例16

1-メチル-2-[2-[2-(2-フェニルエチル)-1-ナフトキシ]エチル]ピロリジン塩酸塩

(a) 1-メチル-2-[2-[2-(2-フェニルエチル)-1-ナフトキシ]エチル]ピロリジン

2-(2-フェニルエチル)-1-ナフトール1000mgをN,N-ジメチルアセトアミド10mlに溶解し、氷冷撹拌下にカリウムt-ブトキシド1130mgを加え、次いで、2-(2-クロロエチル)-1-メチルピロリジン塩酸塩1110mgを加えて溶解し、室温で20時間静置した。反応液を実施例1と同様に後処理し、シリカゲルカラムクロマトグラフィー(溶出溶媒:塩化メチレン/メタノール=10/1)で精製し、標記化合物650mg(収率45%)を油状物として得た。NMRスペクトル(270MHz, CDCl₃) δ ppm: 1.55-1.95 (4H, m)、1.95-2.55 (4H, m)、2.44 (3H, s)、2.9-3.25 (5H, m)、3.9-4.05 (2H, m)、7.15-7.55 (9H, m)、7.75-7.9 (1H, m)、8.06 (1H, d, J=7.9 Hz)。

(b) 1-メチル-2-[2-[2-(2-フェニルエチル)-1-ナフトキシ]エチル]ピロリジン塩酸塩
前記(a)工程で得た1-メチル-2-[2-[2-(2-フェニルエチル)-1-ナフトキシ]エチル]ピロリジン650mgを酢酸エチル5mlに溶解し、4規定塩化水素-酢酸エチル溶液0.68mlを加えた、減圧で濃縮し、無色固体を得た。これを酢酸エチルに溶解し、ヘキサンを加えて静置し、析出した結晶をろ取り、少量の混合溶媒(ヘキサン/酢酸エチル=1/4)で洗浄し、真空で乾燥して、標記化合物685mg(収率96%)を得た。

融点: 54-58℃。

NMRスペクトル(270MHz, CDCl₃) δ ppm: 1.9-2.9 (7H, m)、2.87 (3H, s)、2.9-3.15 (4H, m)、3.35-3.6 (1H, m)、3.8-4.1 (3H, m)、7.1-7.4 (6H, m)、7.4-7.6 (2H, m)、7.62 (1H, d, J=8.5 Hz)、7.8-7.95 (2H, m)。

【0133】実施例17

1-メチル-2-[2-[1-(2-フェニルエチル)-2-ナフトキシ]エチル]ピロリジン塩酸塩

(a) 1-メチル-2-[2-[1-(2-フェニルエ

チル)-2-ナフトキシ]エチル]ピロリジン

1-(2-フェニルエチル)-2-ナフトール600mgをN,N-ジメチルアセトアミド10mlに溶解し、氷冷撹拌下にカリウムt-ブトキシド680mgを加え、次いで、2-(2-クロロエチル)-1-メチルピロリジン塩酸塩670mgを加えて溶解し、室温で64時間静置した。反応液を実施例1と同様に後処理し、シリカゲルカラムクロマトグラフィー(溶出溶媒:塩化メチレン/メタノール=10/1)で精製し、標記化合物410mg(収率47%)を油状物として得た。

NMRスペクトル(270MHz, CDCl₃) δ ppm: 1.55-2.0 (4H, m)、2.0-2.2 (1H, m)、2.2-2.4 (2H, m)、2.4-2.6 (1H, m)、2.43 (3H, s)、2.8-3.0 (2H, m)、3.1-3.3 (1H, m)、3.3-3.45 (2H, m)、4.0-4.25 (2H, m)、7.15-7.4 (7H, m)、7.45-7.55 (1H, m)、7.74 (1H, d, J=9.0 Hz)、7.76 (1H, d, J=7.8 Hz)、8.02 (1H, d, J=8.6 Hz)。

(b) 1-メチル-2-[2-[1-(2-フェニルエチル)-2-ナフトキシ]エチル]ピロリジン塩酸塩
前記(a)工程で得た1-メチル-2-[2-[1-(2-フェニルエチル)-2-ナフトキシ]エチル]ピロリジン410mgを酢酸エチル5mlに溶解し、4規定塩化水素-酢酸エチル溶液0.43mlを加えた。減圧で濃縮し、無色固体を得た。これを酢酸エチルに溶解し、ヘキサンを加えて静置し、析出した結晶をろ取り、少量の混合溶媒(ヘキサン/酢酸エチル=1/2)で洗浄し、真空で乾燥して、標記化合物390mg(収率86%)を得た。

融点: 102-103℃。

NMRスペクトル(270MHz, CDCl₃) δ ppm: 1.85-2.15 (2H, m)、2.15-2.4 (2H, m)、2.4-2.65 (2H, m)、2.65-2.85 (1H, m)、2.74 (3H, s)、2.85-3.05 (2H, m)、3.2-3.5 (3H, m)、3.8-3.95 (1H, m)、3.95-4.1 (1H, m)、4.2-4.35 (1H, m)、7.15-7.45 (7H, m)、7.45-7.6 (1H, m)、7.77 (1H, d, J=9.0 Hz)、7.83 (1H, d, J=7.7 Hz)、8.01 (1H, d, J=8.6 Hz)。

【0134】実施例18

N,N-ジメチル-3-[4-ヒドロキシ-2-(2-フェニルエチル)フェノキシ]プロピルアミン塩酸塩

(a) N,N-ジメチル-3-[4-メトキシメトキシ-2-(2-フェニルエチル)フェノキシ]プロピルアミン

参考例12で得た3-ブロモプロピル [4-メトキシ

メトキシ-2-(2-フェニルエチル)フェニル]エーテル303mgをテトラヒドロフラン4mlに溶解し、50%ジメチルアミン水溶液0.82mlを加え、40℃で5時間攪拌した。反応液を減圧で濃縮し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(溶出溶剤:塩化メチレン/メタノール=4/1)で精製し、標記化合物259mg(収率94%)を無色固体として得た。
NMRスペクトル(270MHz, CDCl₃) δ ppm: 2.25-2.4(2H, m)、2.69(6H, s)、2.87(4H, s)、3.0-3.15(2H, m)、3.47(3H, s)、4.00(2H, t, J=5.7Hz)、5.09(2H, s)、6.65-6.8(1H, m)、6.8-6.9(2H, m)、7.1-7.4(5H, m)。

(b) N, N-ジメチル-3-[4-ヒドロキシ-2-(2-フェニルエチル)フェノキシ]プロピルアミン塩酸塩

前記(a)工程で得たN, N-ジメチル-3-[4-メトキシメトキシ-2-(2-フェニルエチル)フェノキシ]プロピルアミン255mgをジオキサン4mlに溶解し、4規定塩化水素-ジオキサン溶液4mlを加え、室温に2.5時間静置した。減圧濃縮し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(溶出溶剤:塩化メチレン/メタノール=5/1)で精製し、標記化合物216mg(収率87%)を無色固体として得た。

NMRスペクトル(270MHz, DMSO-d₆) δ ppm: 2.0-2.2(2H, m)、2.7-2.9(4H, m)、2.79(6H, s)、3.15-3.25(2H, m)、3.92(2H, t, J=6.0Hz)、6.5-6.65(2H, m)、6.77(1H, d, J=8.6Hz)、7.15-7.4(5H, m)。

【0135】実施例19

2-[2-[4-ヒドロキシ-2-(2-フェニルエチル)フェノキシ]エチル]-1-メチルピロリジン塩酸塩

(a) 1-メチル-2-[2-[4-メトキシメトキシ-2-(2-フェニルエチル)フェノキシ]エチル]ピロリジン

参考例11で得た4-メトキシメトキシ-2-(2-フェニルエチル)フェノール800mgをN, N-ジメチルアセトアミド15mlに溶解し、氷冷攪拌下にカリウムt-ブトキシド765mgを加え、次いで、2-(2-クロロエチル)-1-メチルピロリジン塩酸塩855mgを加え、室温として14時間攪拌した。反応液に水と酢酸エチルを加えて分液し、酢酸エチル層を分離し、食塩水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで脱水乾燥し、減圧濃縮して、油状物を得た。これをシリカゲルカラムクロマトグラフィー(溶出溶剤:塩化メチレン/メタノール=9/1)で精製し、標記化合物345mg(収率30%)を油脂状物として得た。

NMRスペクトル(270MHz, CDCl₃) δ ppm: 1.6-2.0(4H, m)、2.0-2.2(1H, m)、2.15-2.45(2H, m)、2.47(3H, s)、2.5-2.7(1H, m)、2.87(4H, s)、3.25-3.4(1H, m)、3.47(3H, s)、3.85-4.0(1H, m)、4.0-4.15(1H, m)、5.08(2H, s)、6.7-6.9(3H, m)、7.1-7.35(5H, m)。

(b) 2-[2-[4-ヒドロキシ-2-(2-フェニルエチル)フェノキシ]エチル]-1-メチルピロリジン塩酸塩

前記(a)工程で得た1-メチル-2-[2-[4-メトキシメトキシ-2-(2-フェニルエチル)フェノキシ]エチル]ピロリジン345mgをジオキサン5mlに溶解し、4規定塩化水素-ジオキサン溶液4mlを加え、室温で2.5時間攪拌した。反応液を減圧濃縮し、真空中で乾燥して、標記化合物337mg(定量的)を固体として得た。

NMRスペクトル(270MHz, DMSO-d₆) δ ppm: 1.65-2.15(4H, m)、2.15-2.5(2H, m)、2.65-2.9(5H, m)、2.9-3.1(1H, m)、3.34(3H, s)、3.45-3.6(1H, m)、3.85-4.05(2H, m)、6.5-6.65(2H, m)、6.78(1H, d, J=8.6Hz)、7.15-7.35(5H, m)。

【0136】参考例1

4-フェニル-2-(2-フェニルエチル)フェノール
(a) 5-フェニルサリチルアルデヒド

5-ブロモサリチルアルデヒド11gをエタノール/トルエン混合液(50%v/v)100mlに溶解し、フェニル硼酸10gを窒素気流中、室温で加え、攪拌した。次いで、20%水酸化パラジウム-炭素触媒1gおよび2M-炭酸ナトリウム水溶液100mlを順次加え、120℃で3時間攪拌した。触媒をろ過して不溶物を除去し、ろ液に酢酸エチルと水を加えて、分液した。酢酸エチル層を食塩水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで脱水し、減圧濃縮して固体を得た。この固体をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(溶出溶剤:ヘキサン/酢酸エチル=7/1)で精製し、標記化合物1.2g(収率11%)を固体として得た。

NMRスペクトル(270MHz, CDCl₃) δ ppm: 7.07(1H, d, J=8.4Hz)、7.3-7.6(5H, m)、7.7-7.85(2H, m)、9.99(1H, s)、11.0(1H, s)。

(b) 4-フェニル-2-(2-フェニルエチル)フェノール
前記(a)工程で得た5-フェニルサリチルアルデヒド1.2gをアセトニトリル20ml中、ベンジルトリフェニルホスホニウムクロリド2.5gと共に80℃で加熱攪拌し、1, 8-ジアザビスクロ[5.4.

0]ーウンデサー7ーエン (DBU) 1 ml をアセトニトリル 5 ml に溶解して滴下し、さらに2時間攪拌した。溶媒を減圧留去し、シリカゲルカラムクロマトグラフィー (溶出溶剤: ベンゼン/アセトニトリル=4/1) で精製し、標記化合物 1.52 g (収率92%) の固体を得た。

(c) 4ーフェニルー2ー (2ーフェニルエチル) フェノール

前記 (b) 工程で得た 4ーフェニルー2ー (2ーフェニルエチル) フェノール 1.5 g をエタノール 15 ml に溶解し、5%パラジウムー炭素触媒 150 mg を加え、水素気流中 50℃ で1.5時間加熱攪拌した。反応液を冷却し、触媒をろ去し、減圧濃縮して溶媒を除き、シリカゲルカラムクロマトグラフィー (溶出溶剤: ヘキサン/酢酸エチル=9/1) で精製し、標記化合物 1.43 g (収率94%) を無色固体として得た。

NMR スペクトル (270MHz, CDCl₃) δ ppm: 2.97 (4H, s)、6.82 (1H, d, J=8.9 Hz)、7.15-7.6 (12H, m)。

【0137】参考例2

3ープロモプロピル [4ーフェニルー2ー (2ーフェニルエチル) フェニル] エーテル

苛性カリ (85%) 0.30 g を 1 ml の水に溶解し、tーブタノール 10 ml を加え、さらに 4ーフェニルー2ー (2ーフェニルエチル) フェノール 700 mg を加えて、50℃ で攪拌した。この溶液にジブロモプロパン 0.82 ml を加え、80℃ で2時間攪拌した。反応液に氷水とベンゼンを加えて分液し、ベンゼン層を食塩水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで脱水し、減圧濃縮して、油状物を得た。これをシリカゲルカラムクロマトグラフィー (溶出溶剤: ヘキサン/ベンゼン=4/1) で精製し、標記化合物 380 mg (収率37%) を無色油脂状物として得た。

NMR スペクトル (270MHz, CDCl₃) δ ppm: 2.3-2.5 (2H, m)、2.85-3.05 (4H, m)、3.64 (2H, t, J=6.5 Hz)、4.15 (2H, t, J=5.7 Hz)、6.94 (1H, d, J=8.5 Hz)、7.15-7.6 (12H, m)。

【0138】参考例3

5ーフェニルー2ー (2ーフェニルエチル) フェノール
(a) ベンジル 5ーフェニルー2ー (2ーフェニルエチル) フェニル エーテル

2ーベンジルオキシー4ーフェニルベンズアルデヒド 4.30 g をアセトニトリル 150 ml に溶解し、ベンジルトリフェニルホスホニウムクロリド 6.00 g を加え、80℃ で加熱攪拌しながら、DBU 2.30 ml のアセトニトリル 5 ml 溶液を滴下し、さらに2時間攪拌した。溶媒を減圧留去し、シリカゲルカラムクロマトグラフィー (溶出溶剤: ヘキサン/ベンゼン=4/1) で

精製し、標記化合物 5.20 g (収率96%) を油状物として得た。

(b) 5ーフェニルー2ー (2ーフェニルエチル) フェノール

前記 (a) 工程で得たベンジル 5ーフェニルー2ー (2ーフェニルエチル) フェニル エーテル 5.20 にエタノール 100 ml を加え、5%パラジウムー炭素触媒 600 mg を加えて、水素気流中 50℃ で3時間加熱攪拌した。冷却し、触媒をろ去し、減圧濃縮して得た固体をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (溶出溶剤: ヘキサン/酢酸エチル=9/1) で精製し、標記化合物 2.39 g (収率60%) を無色固体として得た。
NMR スペクトル (270MHz, CDCl₃) δ ppm: 2.96 (4H, s)、6.95-7.6 (13H, m)。

【0139】参考例4

3ープロモプロピル [5ーフェニルー2ー (2ーフェニルエチル) フェニル] エーテル

苛性カリ (85%) 0.11 g を 1 ml の水に溶解し、tーブタノール 10 ml を加え、さらに 5ーフェニルー2ー (2ーフェニルエチル) フェノール 500 mg を加えて、80℃ で攪拌した。この溶液にジブロモプロパン 1.82 ml を加え、同温度で7時間攪拌した。参考例2と同様に後処理し、シリカゲルカラムクロマトグラフィー (溶出溶剤: ヘキサン/ベンゼン=4/1) で精製し、標記化合物 600 mg (収率83%) を無色固体として得た。

NMR スペクトル (270MHz, CDCl₃) δ ppm: 2.3-2.45 (2H, m)、2.85-3.05 (4H, m)、3.65 (2H, t, J=6.5 Hz)、4.20 (2H, t, J=5.7 Hz)、7.05-7.4 (9H, m)、7.44 (2H, t, J=7.4 Hz)、7.59 (2H, d, J=7.4 Hz)。

【0140】参考例5

2ーベンジルオキシー4ーフェニル安息香酸エチル
4ーフェニルサリチル酸エチル 7.60 g を N, Nージメチルアセタミド 100 ml に溶解し、氷冷下にカリウム tーブトキシド 3.80 g を加え、15分攪拌した。これに、同温で臭化ベンジル 4.1 ml を滴下し、室温として2時間攪拌した。反応液に酢酸エチルと水を加えて分液し、酢酸エチル層を2回食塩水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで脱水して、減圧濃縮した。得られた油状物をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (溶出溶剤: ヘキサン/酢酸エチル=9/1) で精製し、標記化合物 8.1 g (収率77%) を油状物として得た。

NMR スペクトル (270MHz, CDCl₃) δ ppm: 1.36 (3H, t, J=7.1 Hz)、4.38 (2H, q, J=7.1 Hz)、5.25 (2H, s)、7.1-7.6 (12H, m)、7.91 (1H, d, J=8.3 Hz)。

【0141】参考例6

2-ベンジルオキシ-4-フェニルベンジルアルコール
水素化アルミニウムリチウム2.7 gをテトラヒドロフラン50 mlに加え、2-ベンジルオキシ-4-フェニル安息香酸エチル8.1 gのテトラヒドロフラン100 ml溶液を氷冷撹拌下に滴下し、後室温として30分撹拌した。再び氷冷して、硫酸ナトリウム10水和物を少しずつ加え過剰の水素化物を分解した。室温で30分撹拌し、不溶物をろ去し、ろ液を減圧濃縮して、標記化合物4.39 g (収率61%)を無色結晶として得た。
NMRスペクトル (270MHz, CDCl₃) δ ppm: 4.78 (2H, s)、5.20 (2H, s)、7.15-7.6 (13H, m)。

【0142】参考例7

2-ベンジルオキシ-4-フェニルベンズアルデヒド
2-ベンジルオキシ-4-フェニルベンジルアルコール
4.38 gを塩化メチレン70 mlに溶解し、二酸化マンガン26.2 gを加えて、室温で16時間撹拌した。不溶物をろ去し、減圧濃縮して、標記化合物4.3 g (収率98%)を無色結晶として得た。

NMRスペクトル (270MHz, CDCl₃) δ ppm: 5.28 (2H, s)、7.2-7.55 (10H, m)、7.58 (2H, d, J=7.0 Hz)、7.93 (1H, d, J=7.9 Hz)、10.57 (1H, s)。

【0143】参考例8

4-フェノキシ-2-(2-フェニルエチル)フェノール

(a) 4-フェノキシ-2-(2-フェニルエチル)フェノール

2-ヒドロキシ-5-フェノキシベンズアルデヒド1.92 gとベンジルトリフェニルホスホニウムクロリド3.83 gをアセトニトリル90 mlに溶解し、加熱還流下にDBU2.01 mlのアセトニトリル(10 ml)溶液を滴下し、3.5時間撹拌した。参考例3

(b) 工程と同様に後処理し、シリカゲルカラムクロマトグラフィー(溶出溶剤:ヘキサン/酢酸エチル=4/1-1/1)で精製し、標記化合物2.34 g (収率91%)を油状物として得た。

(b) 4-フェノキシ-2-(2-フェニルエチル)フェノール

前記(a)工程で得た4-フェノキシ-2-(2-フェニルエチル)フェノール2.34 gにエタノール15 mlを加え、5%パラジウム-炭素触媒250 mgを用い、参考例3(c)工程と同様に反応し、後処理し、シリカゲルカラムクロマトグラフィー(溶出溶剤:ヘキサン/酢酸エチル=17/3)で精製し、標記化合物2.17 g (収率95%)を無色油状物として得た。

NMRスペクトル (270MHz, CDCl₃) δ ppm: 2.8-3.0 (4H, m)、6.7-6.8 (3H, m)、6.8-6.9 (2H, m)、7.03 (1H, t, J=7.6 Hz)、7.1-7.35 (7H, m)。

【0144】参考例9

3-ブロモプロピル [4-フェノキシ-2-(2-フェニルエチル)フェニル]エーテル

苛性カリ(85%)0.136 gを水1 mlに溶解し、
t-ブタノール9 mlを加え、参考例8で得た4-フェノキシ-2-(2-フェニルエチル)フェノール500 mgとジブロモプロパン0.53 mlを参考例4と同様に反応し、後処理し、シリカゲルカラムクロマトグラフィー(溶出溶剤:ヘキサン/酢酸エチル=19/1)で精製し、標記化合物4.63 mg (収率65%)を無色油状物として得た。

NMRスペクトル (270MHz, CDCl₃) δ ppm: 2.25-2.4 (2H, m)、2.88 (4H, s)、3.63 (2H, t, J=6.4 Hz)、4.09 (2H, t, J=5.7 Hz)、6.75-6.95 (5H, m)、7.03 (1H, t, J=7.3 Hz)、7.1-7.35 (7H, m)。

【0145】参考例10

2-ヒドロキシ-5-メトキシメトキシベンズアルデヒド

2,5-ジヒドロキシベンズアルデヒド3.10 gとジメトキシメタン6.83 gを塩化メチレン50 mlに溶解し、p-トルエンスルホン酸・1水和物0.43 gを加え、12時間加熱還流した。反応液を水及び食塩水で順次洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥して、減圧濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(溶出溶剤:ヘキサン/酢酸エチル=4/1)で精製し、標記化合物1.03 g (収率25%)を油状物として得た。

NMRスペクトル (270MHz, CDCl₃) δ ppm: 3.50 (3H, s)、5.15 (2H, s)、6.9-7.0 (1H, m)、7.2-7.3 (2H, m)、9.85 (1H, s)、10.71 (1H, s)。

【0146】参考例11

4-メトキシメトキシ-2-(2-フェニルエチル)フェノール

(a) 4-メトキシメトキシ-2-(2-フェニルエチル)フェノール

2-ヒドロキシ-5-メトキシメトキシベンズアルデヒド1.01 gとベンジルトリフェニルホスホニウムクロリド2.95 gをアセトニトリル45 ml中、DBU1.24 mlを用い、参考例3(b)と同様に1時間反応し、後処理し、シリカゲルカラムクロマトグラフィー(溶出溶剤:ヘキサン/酢酸エチル=7/3)で精製し、標記化合物1.41 g (収率99%)を油状物として得た。

(b) 4-メトキシメトキシ-2-(2-フェニルエチル)フェノール

前記(a)工程で得た4-メトキシメトキシ-2-(2-フェニルエチル)フェノール1.41 gをエタノール

ル10ml中で、5%パラジウム-炭素触媒140mgを用い、参考例3(c)工程と同様に反応し、後処理し、シリカゲルカラムクロマトグラフィー(溶出溶剤:ヘキサン/酢酸エチル=4/1)で精製し、標記化合物1.32g(収率93%)を無色固体として得た。
NMRスペクトル(270MHz, CDCl₃) δ ppm: 2.8-3.0(4H, m)、3.47(3H, s)、5.07(2H, s)、6.6-6.7(1H, m)、6.75-6.85(2H, m)、7.15-7.35(5H, m)。

【0147】参考例12

3-ブロモプロピル [4-メトキシメトキシ-2-(2-フェニルエチル)フェニル] エーテル
苛性カリ(85%) 0.146gを水1mlに溶解し、
t-ブタノール9mlを加え、参考例8で得た4-メトキシメトキシ-2-(2-フェニルエチル)フェノール475mgとジブロモプロパン0.56mlを参考例4と同様に反応し、後処理し、シリカゲルカラムクロマトグラフィー(溶出溶剤:ヘキサン/酢酸エチル=9/1)で精製し、標記化合物545mg(収率78%)を無色油状物として得た。

NMRスペクトル(270MHz, CDCl₃) δ ppm: 2.25-2.4(2H, m)、2.87(4H, s)、3.46(3H, s)、3.61(2H, t, J=6.5Hz)、4.05(2H, t, J=5.7Hz)、5.08(2H, s)、6.7-6.95(3H, m)、7.1-7.4(5H, m)。

【0148】参考例13

4-ブトキシ-2-(2-フェニルエチル)フェノール
2-ヒドロキシ-5-ブトキシベンズアルデヒド5.20gとベンジルトリフェニルホスホニウムクロリド2.50gをアセトニトリル50ml中、DBU4.8mlを用い、参考例3(b)工程と同様に2時間反応し、後処理して、シリカゲルカラムクロマトグラフィー(溶出溶剤:ヘキサン/酢酸エチル=6/1)で精製し、標記化合物の無色固体5.68g(収率79%)を得た。

【0149】参考例14

4-ブトキシ-2-(2-フェニルエチル)フェノール
参考例13で得た4-ブトキシ-2-(2-フェニルエチル)フェノール5.68gをエタノール56ml中で、5%パラジウム炭素触媒500mgを用い、参考例3(c)工程と同様に反応し、後処理して、シリカゲルカラムクロマトグラフィー(溶出溶剤:ヘキサン/酢酸エチル=5/1)で精製し、標記化合物5.56g(収率97%)を油状物として得た。

NMRスペクトル(270MHz, CDCl₃) δ ppm: 0.96(3H, t, J=7.3Hz)、1.4-1.55(2H, m)、1.65-1.8(2H, m)、2.8-

3.0(4H, m)、3.86(2H, t, J=6.5Hz)、6.6-6.7(3H, m)、7.15-7.35(5H, m)。

【0150】参考例15

3-ブロモプロピル [4-ブトキシ-2-(2-フェニルエチル)フェニル] エーテル
苛性カリ(85%) 0.18gを水1mlに溶解し、
t-ブタノール9mlを加え、参考例14で得た4-ブトキシ-2-(2-フェニルエチル)フェノール600mgとジブロモプロパン0.68mlを参考例4と同様に反応し、後処理して、シリカゲルカラムクロマトグラフィー(溶出溶剤:ヘキサン/酢酸エチル=8/1)で精製し、標記化合物850mg(収率98%)を無色油状物として得た。

NMRスペクトル(270MHz, CDCl₃) δ ppm: 0.97(3H, t, J=7.4Hz)、1.4-1.55(2H, m)、1.65-1.8(2H, m)、2.25-2.4(2H, m)、2.87(4H, s)、3.62(2H, t, J=6.4Hz)、3.88(2H, t, J=6.4Hz)、4.04(2H, t, J=5.7Hz)、6.65-6.85(3H, m)、7.1-7.35(5H, m)。

【0151】参考例16

3-ブロモプロピル [4-ヒドロキシ-2-(2-フェニルエチル)フェニル] エーテル
参考例12で得た3-ブロモプロピル [4-メトキシメトキシ-2-(2-フェニルエチル)フェニル] エーテル238mgを酢酸エチル4mlに溶解し、4規定塩化水素-酢酸エチル溶液4mlを加え、室温に2時間静置した。減圧濃縮し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(溶出溶剤:ヘキサン/酢酸エチル=3/1)で精製し、標記化合物202mg(収率96%)を無色油状物として得た。

NMRスペクトル(270MHz, CDCl₃) δ ppm: 2.25-2.4(2H, m)、2.86(4H, s)、3.61(2H, t, J=6.5Hz)、4.03(2H, t, J=5.8Hz)、6.55-6.7(2H, m)、6.7-6.8(1H, m)、7.15-7.35(5H, m)。

【0152】参考例17

3-ブロモプロピル [4-プロパルギルオキシ-2-(2-フェニルエチル)フェニル] エーテル
参考例16で得た3-ブロモプロピル [4-ヒドロキシ-2-(2-フェニルエチル)フェニル] エーテル109mgをアセトン4mlに溶解し、プロパルギルブロミド0.036mlおよび炭酸カリ45mgを加え、40℃で14時間攪拌した。反応液に酢酸エチルと水を加えて分液し、酢酸エチル層を食塩水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで脱水し、減圧濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(溶出溶剤:ヘキサン/

酢酸エチル＝9/1)で精製し、標記化合物9.2mg(収率76%)を無色油状物として得た。

NMRスペクトル (270MHz, CDCl_3) δ ppm: 2.25–2.4 (2H, m)、2.49 (1H, t, $J=2.5$ Hz)、2.88 (4H, s)、3.61 (2H, t, $J=6.4$ Hz)、4.05 (2H, t, $J=5.7$ Hz)、4.60 (2H, d, $J=2.5$ Hz)、6.75–6.85 (3H, m)、7.15–7.35 (5H, m)。

【0153】参考例18

5-ブトキシ-2-ヒドロキシベンズアルデヒド
4-ブトキシフェノール10.0gをエタノール13mLに溶解し、苛性ソーダ水溶液(19.3g/65mL)を加え、70℃に加熱撹拌しながらクロロホルム9.6mLをゆっくり滴下し、同温で3時間撹拌した。冷却後、塩酸を用いてpH2とし、酢酸エチルで抽出した。抽出液を水及び食塩水で順次洗浄し、で乾燥し、減圧濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(溶出溶媒:ヘキサン/酢酸エチル＝10/1)で精製し、標記化合物4.50g(収率39%)を固体として得た。

NMRスペクトル (270MHz, CDCl_3) δ ppm: 0.99 (3H, t, $J=7.3$ Hz)、1.45–1.6 (2H, m)、1.7–1.85 (2H, m)、3.95 (2H, t, $J=6.5$ Hz)、6.92 (1H, d, $J=9.0$ Hz)、7.00 (1H, d, $J=3.0$ Hz)、7.15 (1H, dd, $J=3.0$ 及び9.0 Hz)、9.85 (1H, s)、10.64 (1H, s)。

【0154】参考例19

(3-ベンジルオキシ-2-ナフチル)メタノール
3-ヒドロキシメチル-2-ナフトール32.5gをN,N-ジメチルアセタミド300mLに溶解し、氷冷撹拌下にカリウム t-ブトキシド20.9gを徐々に加え、室温としベンジルブロミド22.2mLをゆっくり滴下し、同温度で5時間撹拌した。水200mLおよび酢酸エチル600mLを加えて、酢酸エチルで抽出し、抽出液を水および食塩水で順次洗浄し、無水硫酸マグネシウムで脱水し、減圧濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(溶出溶媒:ヘキサン/酢酸エチル＝4/1)で精製して、標記化合物24.6gの無色固体を得た。

NMRスペクトル (270MHz, CDCl_3) δ ppm: 4.89 (2H, s)、5.24 (2H, s)、7.2–7.65 (8H, m)、7.7–7.85 (3H, m)。

【0155】参考例20

(3-ベンジルオキシ-2-ナフチル)メチルホスホニウムクロリド

参考例19で得た(3-ベンジルオキシ-2-ナフチル)メタノール25.7gをテトラヒドロフラン300

mLに溶解し、氷冷撹拌下に塩化チオニル7.62mLを滴下し、室温で14時間撹拌した。反応液を減圧で濃縮し、真空中で乾燥して、固体を得た。これをトルエン200mLに溶解し、トリフェニルホスフィン25.1gを加え、10時間加熱還流した。反応液を冷却し、固体をろ取り、トルエンで洗浄し、真空中で乾燥して、標記化合物20.9g(収率60%)を無色固体として得た。
NMRスペクトル (270MHz, CDCl_3) δ ppm: 4.54 (2H, s)、5.65 (2H, d, $J=14.5$ Hz)、6.95 (1H, s)、7.1–7.8 (24H, m)、8.01 (1H, d, $J=4.0$ Hz)。

【0156】参考例21

(2-ベンジルオキシ-1-ナフチル)メタノール
水素化リチウムアルミニウム3.55gをテトラヒドロフラン500mL中に氷冷撹拌下に加え、2-ベンジルオキシ-1-ナフトアルデヒド24.5gをテトラヒドロフラン100mLに溶解して、同温で滴下し、室温で3時間撹拌した。再び冷却して、硫酸ナトリウム10水和物を徐々に加えて、過剰の水素化物を分解し、不溶物をろ去し、ろ液を減圧濃縮した。濃縮物を少量の酢酸エチルに溶解し、ヘキサンを加えた。析出した結晶をろ取り、混合溶媒(ヘキサン/酢酸エチル＝1/1)で洗浄し、真空中で乾燥して、標記化合物20.2g(収率82%)を無色結晶として得た。

NMRスペクトル (270MHz, CDCl_3) δ ppm: 5.20 (2H, s)、5.26 (2H, s)、7.3–7.6 (8H, m)、7.75–7.9 (2H, m)、8.13 (1H, d, $J=8.6$ Hz)。

【0157】参考例22

(2-ベンジルオキシ-1-ナフチル)メチルトリフェニルホスホニウムクロリド

参考例21で得た(2-ベンジルオキシ-1-ナフチル)メタノール20.2gをテトラヒドロフラン300mL、塩化チオニル6.00mLを用いて、参考例20と同様に反応し、反応液を濃縮乾燥して、2-ベンジルオキシ-1-クロロメチルナフタレンを得た。これをトルエン100mLに溶解し、トリフェニルホスフィン25.4gを加え、8時間加熱還流した。反応液を冷却し、固体をろ取り、トルエンで洗浄し、真空中で乾燥して、標記化合物36.4g(収率93%)を無色固体として得た。

NMRスペクトル (270MHz, CDCl_3) δ ppm: 4.64 (2H, s)、5.46 (2H, d, $J=13.5$ Hz)、7.03 (1H, d, $J=9.0$ Hz)、7.15–7.55 (19H, m)、7.6–7.9 (6H, m)。

【0158】参考例23

1-(2-フェニルエチル)-2-ナフトール
(2-ベンジルオキシ-1-ナフチル)メチルトリフェニルホスホニウムクロリド5.65gとベンズアルデヒド

ド1.00 gをアセトニトリル55 ml中、DBU1.7 mlを用いて、参考例1 (b) 工程と同様に反応し、後処理し、シリカゲルカラムクロマトグラフィー（溶出溶媒：ヘキサン／酢酸エチル＝10／1）で精製して、2-ベンジルオキシ-1-（2-フェニルエチル）ナフタレン2.45 gを無色固体として得た。これをエタノール25 mlに溶解し、5%パラジウム-炭素触媒250 mgを加え、水素気流中室温で6時間攪拌した。触媒をろ去し、ろ液を濃縮乾燥し、塩化メチレン20 mlに溶解し、1 M三臭化ホウ素-塩化メチレン溶液6.6 mlを氷冷下に加え、同温度で2時間静置した。反応液を減圧濃縮し、濃縮物をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（溶出溶媒：ヘキサン／酢酸エチル＝4／1）で精製して、標記化合物1.56 g（収率67%）の無色固体を得た。

NMRスペクトル (270MHz, CDCl_3) δ ppm: 2.97 (2H, t, $J=7.9$ Hz)、3.34 (2H, t, $J=7.9$ Hz)、7.02 (1H, d, $J=8.7$ Hz)、7.15-7.45 (6H, m)、7.51 (1H, t, $J=8.2$ Hz)、7.64 (1H, d, $J=8.8$ Hz)、7.79 (1H, d, $J=8.0$ Hz)、7.98 (1H, d, $J=8.5$ Hz)。

【0159】参考例24

3-（2-フェニルエチル）-2-ナフトール（2-ベンジルオキシ-3-ナフチル）メチルトリフェニルホスホニウムクロリド4.28 gとベンズアルデヒド0.76 gをアセトニトリル15 ml中、DBU1.3 mlを用いて、参考例1 (b) 工程と同様に反応し、後処理し、シリカゲルカラムクロマトグラフィー（溶出溶媒：ヘキサン／酢酸エチル＝10／1）で精製して、2-ベンジルオキシ-3-（2-フェニルエチル）ナフタレン2.04 gを無色固体として得た。これをエタノール20 mlとテトラヒドロフラン8 mlの混合液に溶解し、5%パラジウム-炭素触媒200 mgを加え水素気流中、室温で3時間攪拌した。触媒をろ去し、ろ液を濃縮乾燥し、塩化メチレン36 mlに溶解し、1 M三臭化ホウ素-塩化メチレン溶液5.4 mlを氷冷下に加えて、室温で1時間静置した。反応液を減圧濃縮し、濃縮物をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（溶出溶媒：ヘキサン／酢酸エチル＝4／1）で精製して、標記化合物1.17 g（収率66%）の無色固体を得た。

NMRスペクトル (270MHz, CDCl_3) δ ppm: 2.95-3.15 (4H, m)、7.15-7.45 (8H, m)、7.56 (1H, s)、7.64 (1H, d, $J=8.0$ Hz)、7.70 (1H, d, $J=8.1$ Hz)。

【0160】参考例25

(2S, 4R)-4-ヒドロキシ-1-オクチルオキシカルボニルプロリンエチル
L-プロリンエチルエステル塩酸塩20 gを塩化メチレ

ン300 ml中、トリエチルアミン31 mlと共に氷冷下に攪拌し、クロル炭酸オクチル22 mlを滴下し、同温で2時間攪拌した。減圧濃縮し、酢酸エチルと水を加えて分液し、酢酸エチル層を食塩水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥し、減圧で濃縮した。濃縮物をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（溶出溶媒：ヘキサン／酢酸エチル＝1／2）で精製して、油状の標記化合物29.4 g（収率90%）を得た。

NMRスペクトル (270MHz, CDCl_3) δ ppm: 0.88 (3H, t, $J=6.6$ Hz)、1.15-1.45 (13H, m)、1.45-1.7 (2H, m)、1.7-1.9 (1H, m)、2.05-2.15 (1H, m)、2.2-2.4 (1H, m)、3.45-3.75 (2H, m)、3.95-4.3 (4H, m)、4.4-4.6 (1H, m)。

【0161】参考例26

(2S, 4R)-4-ジメチルカルバモイルオキシ-1-オクチルオキシカルボニルプロリン エチル
氷冷攪拌下にトリホスゲン21.1 gをピリジン300 ml中に徐々に加え、室温として30分攪拌した。これに参考例25で得た(2S, 4R)-4-ヒドロキシ-1-オクチルオキシカルボニルプロリン エチル22.5 gをピリジン200 mlに溶解して滴下し、さらに30分攪拌し、ジメチルアミン14.5 gを加えて、室温とし20分攪拌した。反応液を氷水中に注加し、酢酸エチルで抽出した。抽出液を食塩水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで脱水し、減圧濃縮した。濃縮物をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（溶出溶媒：ヘキサン／酢酸エチル＝1／1）で精製して、油状の標記化合物27.2 g（収率98%）を得た。

NMRスペクトル (270MHz, CDCl_3) δ ppm: 0.88 (3H, t, $J=6.7$ Hz)、1.15-1.45 (13H, m)、1.5-1.75 (2H, m)、2.2-2.3 (1H, m)、2.35-2.55 (1H, m)、2.87 (3H, s)、2.91 (3H, s)、3.6-3.85 (2H, m)、3.95-4.3 (4H, m)、4.35-4.5 (1H, m)、5.2-5.3 (1H, m)。

【0162】参考例27

(2S, 4R)-4-ジメチルカルバモイルオキシ-1-オクチルオキシカルボニル-2-(p-トルエンスルホニルオキシメチル)ピロリジン

(a) (2S, 4R)-4-ジメチルカルバモイルオキシ-2-ヒドロキシメチル-1-オクチルオキシカルボニルピロリジン

水素化ほう素リチウム4.70 gをテトラヒドロフラン100 mlに氷冷攪拌下に加え、次いで参考例26で得た(2S, 4R)-4-ジメチルカルバモイルオキシ-1-オクチルオキシカルボニルプロリン エチル28.3 gをテトラヒドロフラン300 mlに溶解して滴下

し、室温として2時間攪拌した。再び冷却し、希塩酸を加えて、過剰の水素化物を分解した。酢酸エチルを加えて目的物を抽出し、抽出液を食塩水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで脱水し、減圧濃縮した。濃縮物をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（溶出溶媒：ヘキサン／酢酸エチル＝1／5）で精製して、油状の標記化合物23.6g（収率93%）を得た。

NMRスペクトル (270MHz, CDCl_3) δ ppm: 0.89 (3H, t, $J=6.7\text{ Hz}$)、1.15–1.45 (10H, m)、1.5–1.7 (2H, m)、1.7–1.85 (1H, m)、2.15–2.3 (1H, m)、2.87 (3H, s)、2.91 (3H, s)、3.55–3.9 (3H, m)、3.57 (1H, d, $J=4.1$ および 12.8 Hz)、4.05–4.2 (1H, m)、4.10 (2H, t, $J=6.6\text{ Hz}$)、5.1–5.2 (1H, m)。

【0163】(b) (2S, 4R)–4–ジメチルカルバモイルオキシ–1–オクチルオキシカルボニル–2–(p–トルエンスルホンオキシメチル)ピロリジン前記(a)工程で得た(2S, 4R)–4–ジメチルカルバモイルオキシ–1–オクチルオキシカルボニル–2–ヒドロキシメチルピロリジン23.6gを塩化メチレン300mlに溶解し、p–トルエンスルホン酸無水物44.7gを加えて溶解し、氷冷し、攪拌下、トリエチルアミン19mlを滴下し、室温として1時間攪拌した。反応液を減圧濃縮し、酢酸エチルと水を加えて分液した。酢酸エチル層を食塩水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで脱水し、減圧濃縮した。濃縮物をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（溶出溶媒：ヘキサン／酢酸エチル＝3／2）で精製して、油状の標記化合物32.5g（収率95%）を得た。

NMRスペクトル (270MHz, CDCl_3) δ ppm: 0.89 (3H, t, $J=6.5\text{ Hz}$)、1.15–1.4 (10H, m)、1.45–1.7 (2H, m)、2.1–2.3 (2H, m)、2.45 (3H, s)、2.83 (3H, s)、2.89 (3H, s)、3.35–3.85 (2H, m)、3.85–4.4 (5H, m)、5.1–5.2 (1H, m)、7.34 (2H, d, $J=8.3\text{ Hz}$)、7.77 (2H, d, $J=8.3\text{ Hz}$)。

【0164】参考例28

(2R, 4R)–2–シアノメチル–4–ジメチルカルバモイルオキシ–1–オクチルオキシカルボニルピロリジン

参考例27で得た(2S, 4R)–4–ジメチルカルバモイルオキシ–1–オクチルオキシカルボニル–2–(p–トルエンスルホンオキシメチル)ピロリジン32.5gをジメチルホルムアミド350mlに溶解し、80℃に加熱攪拌しながら青酸ソーダ0.80gを15分間隔で4回にわたって計3.20g加え、同温で1.

5時間攪拌した。反応液に水を加え、酢酸エチルで抽出した。抽出液を食塩水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで脱水し、減圧濃縮した。濃縮物をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（溶出溶媒：ヘキサン／酢酸エチル＝1／1）で精製して、油状の標記化合物22.1g（収率95%）を得た。

NMRスペクトル (270MHz, CDCl_3) δ ppm: 0.89 (3H, t, $J=6.7\text{ Hz}$)、1.15–1.45 (10H, m)、1.5–1.75 (2H, m)、2.05–2.25 (1H, m)、2.35–2.55 (1H, m)、2.7–2.9 (1H, m)、2.85 (3H, s)、2.91 (3H, s)、3.05–3.3 (1H, m)、3.55–3.95 (2H, m)、4.0–4.25 (1H, m)、4.09 (2H, t, $J=6.6\text{ Hz}$)、5.15–5.3 (1H, m)。

【0165】参考例29

(2S, 4R)–2–(4–ジメチルカルバモイルオキシ–1–オクチルオキシカルボニル–2–ピロリジン)酢酸エチル

参考例28で得た(2R, 4R)–2–シアノメチル–4–ジメチルカルバモイルオキシ–1–オクチルオキシカルボニルピロリジン22.1gをエタノール100mlに溶解し、塩化水素を導入して飽和し、さらに塩化水素を通じながら3.5時間加熱還流した。減圧濃縮し、濃縮物をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（溶出溶媒：ヘキサン／酢酸エチル＝2／1）で精製して、油状の標記化合物18.8g（収率75%）を得た。

NMRスペクトル (270MHz, CDCl_3) δ ppm: 0.88 (3H, t, $J=6.6\text{ Hz}$)、1.2–1.45 (10H, m)、1.25 (3H, t, $J=7.1\text{ Hz}$)、1.5–1.75 (2H, m)、1.9–2.15 (1H, m)、2.3–2.5 (2H, m)、2.85 (3H, s)、2.90 (3H, s)、2.9–3.2 (1H, m)、3.54 (1H, dd, $J=3.9$ 及び 12.7 Hz)、3.55–3.9 (1H, m)、4.0–4.2 (2H, m)、4.13 (2H, q, $J=7.1\text{ Hz}$)、4.2–4.35 (1H, m)、5.1–5.25 (1H, m)。

【0166】参考例30

(2R, 4R)–4–ジメチルカルバモイルオキシ–2–(2–ヒドロキシエチル)–1–オクチルオキシカルボニルピロリジン

参考例29で得た(2S, 4R)–2–(4–ジメチルカルバモイルオキシ–1–オクチルオキシカルボニル–2–ピロリジン)酢酸エチル17.2g、水素化ほう素リチウム5.60g及びテトラヒドロフラン100mlを用い、参考例27(a)工程と同様に反応し、後処理し、シリカゲルカラムクロマトグラフィー（溶出溶媒：ヘキサン／酢酸エチル＝1／1）で精製して、油状の標記化合物11.4g（収率74%）を得た。

NMRスペクトル (270MHz, CDCl_3) δ ppm: 0.88 (3H, t, $J=6.6\text{ Hz}$)、1.2–1.45 (10H, m)、1.45–2.05 (5H, m)、2.2–2.35 (1H, m)、2.85 (3H, s)、2.91 (3H, s)、3.27 (1H, dd, $J=5.1$ および 12.4 Hz)、3.55–3.8 (3H, m)、4.09 (2H, t, $J=6.7\text{ Hz}$)、4.2–4.4 (1H, m)、5.15–5.25 (1H, m)。

【0167】参考例31

(2S, 4R)–2–(2–ブロモエチル)–4–ジメチルカルバモイルオキシ–1–オクチルオキシカルボニルピロリジン

参考例30で得た(2R, 4R)–4–ジメチルカルバモイルオキシ–2–(2–ヒドロキシエチル)–1–オクチルオキシカルボニルピロリジン1.00gをテトラヒドロフラン10mlに溶解し、トリフェニルホスフィン1.00gを加えて溶解し、氷冷撹拌下、四臭化炭素1.30gを加えて溶解し、室温として1時間撹拌した。反応液に酢酸エチルと5%重曹水を加えて分液し、酢酸エチル層を順次5%重曹水と食塩水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで脱水し、減圧濃縮した。濃縮物をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(溶出溶媒:ヘキサン/酢酸エチル=1/1)で精製して、油状の標記化合物1.02g(収率86%)を得た。

NMRスペクトル (270MHz, CDCl_3) δ ppm: 0.88 (3H, t, $J=6.6\text{ Hz}$)、1.15–1.5 (10H, m)、1.5–1.75 (2H, m)、1.8–

2.1 (2H, m)、2.2–2.55 (2H, m)、2.85 (3H, s)、2.91 (3H, s)、3.25–3.6 (2H, m)、3.50 (1H, dd, $J=4.6$ および 12.6 Hz)、3.6–3.95 (1H, m)、4.0–4.2 (3H, m)、5.1–5.25 (1H, m)。

【0168】試験例1

血管収縮実験

平滑筋収縮反応は、Van Neutenら(J. Pharmacol. Exp. Ther., 218, 217–230, 1981)の方法によって行った。体重約500gのSD系雄性ラットを放血致死後、尾動脈を摘出した。動脈は付帯組織を除去したのち、(2×20mm)のラセン標本を作製した。この標本を、Tyrode液10mlを含む37℃に保温したマグナス管内に懸垂し、混合ガス(95% O_2 , 5% CO_2)を通気して1時間放置した後、実験に用いた。初期張力として0.5gを負荷し、張力をトランスジューサーを用いて等尺性に記録した。血管収縮薬として、セロトニン $3 \times 10^{-6}\text{ M}$ をマグナス管内に添加し、収縮反応が安定した後に各被検液を累積的に添加し、最後にパパベリン 10^{-4} M を添加した。被検薬添加前に張力を100%とし、パパベリン添加5分後の張力を0%とした。張力を50%まで低下するに要する被検薬の濃度を IC_{50} 値とし、最小二乗法回帰直線により算出した。その結果を表2に示す。

【0169】

【表2】

化合物	$\text{IC}_{50} \quad \mu\text{M}$
実施例1の化合物	0.23
実施例3の化合物	0.19
実施例10の化合物	0.11
実施例15の化合物	0.27

【0170】試験例2

スクアレンシンターゼ阻害活性

スクアレンシンターゼ阻害活性は、文献記載の方法[米国特許第5,102,907号、Anal. Biochem. 203, 310 (1992)等]によって測定した。すなわち、嫌気条件下、16×110mmのスπιツ管で反応を行った。反応液組成を以下に示す。反応液1アッセイ100 μl 中に、50mM $\text{KH}_2\text{PO}_4/\text{K}_2\text{HPO}_4$ (pH 7.5:リン酸二水素カリウム–リン酸水素二カリウム緩衝液、10mM NaF(フッ化ナトリウム)、10mM MgCl_2 (塩化マグネシウム)、2mM DTT (ジチオスレイトール)、50mMアスコルビン酸、20単位/ml アスコルビン酸オキシダーゼ、1mM NADPH(ニコチンアミドアデニンジヌクレオチドリン酸)、10 μM [4- ^{14}C]–FPP(ファルネシルピロリン酸; 58 $\mu\text{Ci}/\mu\text{mol}$

1)、60 $\mu\text{g/ml}$ ラット肝ミクロソーム懸濁液及び阻害剤溶液(試験化合物のメタノールまたは水溶液 5 μl)を含む。ラット肝ミクロソーム懸濁液を最後に添加して反応を開始した。反応は37℃の恒温槽で行い、20分間のインキュベート後、100 μl の40%KOH(含水酸化カリウム)と95% EtOH(含水エタノール)の1:1混合液を添加して、反応を停止した。これをさらに65℃で、30分間加熱した後に冷却し、2mlのヘキサンを加えてスクアレンを抽出した。ヘキサン層のうち1mlを採り、10mlのシンチレーターと混合して、液体シンチレーションカウンターで放射能を測定した。試験化合物の阻害活性は、該酵素反応液中において、該試験化合物を含む被検体を、酵素標品及び基質とコ・インキュベートさせることにより、該酵素活性に対する阻害活性を測定した。好

ましい試験化合物の50% 阻害濃度(IC₅₀)を表3に示す。

【表3】

【0171】

化合物	IC ₅₀ μM
実施例1の化合物	0.20
実施例3の化合物	0.12
実施例10の化合物	0.51
実施例15の化合物	0.48

【0172】

製剤例1

カプセル剤

実施例10の化合物	20.0 mg
乳糖	158.7
トウモロコシデンプン	70.0
ステアリン酸マグネシウム	1.3
	250 mg

上記処方の粉末を混合し、60メッシュのふるいを通した後、この粉末を250mgの3号ゼラチンカプセルに

入れ、カプセル剤とする。

【0173】

製剤例2

錠剤

製造例10の化合物	20.0 mg
乳糖	154.0
トウモロコシデンプン	25.0
ステアリン酸マグネシウム	1.0
	200 mg

上記処方の粉末を混合し、打錠機により打錠して、1錠200mgの錠剤とする。

【0174】この錠剤は必要に応じて糖衣を施すことができる。

【0175】

【発明の効果】化合物(I)は、セロトニン2受容体拮抗作用及びスクアレンシンターゼ阻害活性を併せ持ち、それらの作用が持続的であり、毒性が弱いため、(1)血管内皮細胞や血小板に分布するセロトニン2受容体を遮断し、血小板凝集阻害に基づく血栓性疾患の治療剤も

しくは予防剤(好適には、治療剤)またはこれらの疾患に起因する各種疾病、例えば、冠動脈疾患、脳血管障害等の治療剤もしくは予防剤(好適には、治療剤)として有用であり、(2)コレステロール低下作用に基づく高脂血症及び動脈硬化性疾患の治療剤または予防剤として有用であり、(3)更にセロトニン2受容体拮抗作用とコレステロール低下作用を併せ持つことにより、すぐれた動脈硬化性疾患治療剤または予防剤(好適には、治療剤)として有用である。

フロントページの続き

(51)Int. Cl. 6

識別記号

F I

A 6 1 K 31/40

A E N

A 6 1 K 31/40

A E N

C 0 7 D 207/08

C 0 7 D 207/08

207/12

207/12

211/22

211/22

(72)発明者 谷本 達夫

東京都品川区広町1丁目2番58号 三共株式会社内

PHENOXYALKYLAMINES

Patent number: JP10316634
Publication date: 1998-12-02
Inventor: FUJIMOTO KOICHI; TANAKA NAOKI;
OGAWA TAKETOSHI; TANIMOTO
TATSUO
Applicant: SANKYO CO
Classification:
- international: **C07D211/22; A61K31/135; A61K31/40;**
A61P7/00; A61P7/02; A61P9/10;
A61P43/00; C07C217/18; C07D207/08;
C07D207/12; C07D207/08; C07D211/00;
A61K31/135; A61K31/40; A61P7/00;
A61P9/00; A61P43/00; C07C217/00;
C07D207/00; (IPC1-7): C07C217/18;
A61K31/135; A61K31/40; C07D207/08;
C07D207/12; C07D211/22
- european:
Application number: JP19970125202 19970515
Priority number(s): JP19970125202 19970515

[Report a data error here](#)

Abstract of JP10316634

PROBLEM TO BE SOLVED: To obtain a new compound useful as a therapeutic agent or a preventing agent for thrombotic diseases, hyperlipemia, arteriosclerotic diseases, etc. **SOLUTION:** The compound is represented by formula I [R<1> is a di-1-6C alkylamino, a (substituted)3-6-membered saturated heterocycle, etc.; R<2> a to R<2> c are each H, a (substituted)aryl, etc.; R<3> a to R<3> d are each H, a 1-6C alkoxy, etc.; A is a single bond or a 1-6C alkylene], e.g. 1-methyl-2-[2-[4-phenyl-2-(2-phenylmethyl)phenoxy]-ethyl]pyrrolidine. The compound of formula I is obtained by reacting a compound of formula II (R<4> a to R<4> c are each R<2> a to R<2> c whose hydroxy group is protected), e.g. 4-phenyl-2-(2-phenylthyl)phenol with a compound of formula III (R<1> a is a protected di-1-6C alkylamino, etc.; Z is a halogen, etc.), e.g. 2-(2-chloroethyl)-1-methylpyrrolidine hydrochloride in an inert solvent in the presence of a base, preferably at 10-80 deg.C for 1-24 hr and carrying out removal, etc., of a protecting group.

Data supplied from the **esp@cenet** database - Worldwide